

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2003年2月13日 (13.02.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/011028 A1(51) 国際特許分類: A01N 37/30,
37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C 237/40, 237/42, 257/06,
C07D 239/88, 263/10, 265/08

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/07833

(22) 国際出願日: 2002年8月1日 (01.08.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-234100 2001年8月1日 (01.08.2001) JP
特願2001-310308 2001年10月5日 (05.10.2001) JP
特願2001-334110 2001年10月31日 (31.10.2001) JP
特願2002-156102 2002年5月29日 (29.05.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒101-0054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 沼田 昭 (NUMATA, Akira) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町7-2-2番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 前田 兼成 (MAEDA, Kazushige) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町7-2-2番地1 日産

化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 三田 猛志 (MITA, Takeshi) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町7-2-2番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 三宅 敏郎 (MIYAKE, Toshiro) [JP/JP]; 〒349-0294 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1-4-70 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 瀧井 新自 (TAKII, Shinji) [JP/JP]; 〒349-0294 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1-4-70 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 伊藤 俊紀 (ITO, Toshinori) [JP/JP]; 〒349-0294 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1-4-70 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

(74) 代理人: 津国 肇 (TSUKUNI, Hajime); 〒105-0001 東京都港区虎ノ門1丁目2番12号 SVAX TSBIL Tokyo (JP).

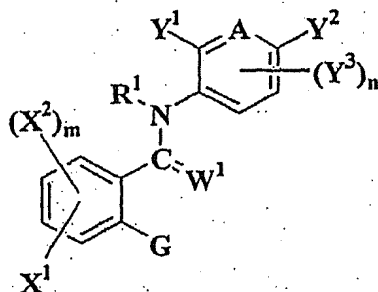
(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR,

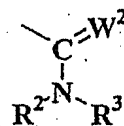
[続葉有]

(54) Title: SUBSTITUTED AMIDES AND PEST CONTROLLERS

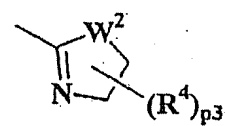
(54) 発明の名称: 置換アミド化合物及び有害生物防除剤



(1)



G-1



G-2

(57) Abstract: Substituted amides represented by the general formula (1) or salts thereof; and pest controllers such as insecticides or acaricides, containing the same: (1) (G-1) (G-2) wherein A is a carbon atom or the like; G is a group represented by the general formula (G-1), (G-2), or the like; W¹ and W² are each independently oxygen or sulfur; X¹ is -N(R⁶)R⁵ or the like; X² is halogeno, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, or the like; Y¹, Y² and Y³ are each independently hydrogen, halogeno, cyano, or the like; R¹, R² and R³ are each independently cyano, C₁₋₁₂ alkyl, C₃₋₁₂ alkenyl, or the like; R⁴ is halogeno, cyano, nitro, or the like; R⁵ and R⁶ are each independently C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₃₋₆ alkenyl, or the like; m and n are each independently an integer of 1 to 3; and p3 is an integer of 1 to 4.

[続葉有]



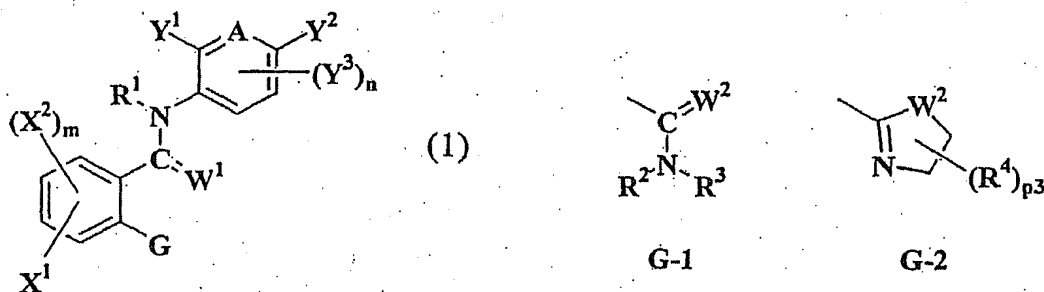
GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特
許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR,
NE, SN, TD, TG).

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:
— 国際調査報告書

(57) 要約:

本発明は、一般式 (1) :



式中、A は炭素原子等を表し、G は G-1 又は G-2 等を表し、 W^1 及び W^2 は各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、 X^1 は $-N(R^6)R^5$ 等を表し、 X^2 はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル等を表し、 Y^1 、 Y^2 及び Y^3 は各々独立して水素原子、ハロゲン原子又はシアノ等を表し、 R^1 、 R^2 及び R^3 は各々独立してシアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル等を表し、 R^4 はハロゲン原子、シアノ又はニトロ等を表し、 R^5 及び R^6 は各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ アルケニル等を表し、 m 及び n は各々独立して 1 ～ 3 の整数を表し、 p_3 は 1 ～ 4 の整数を表す、
で表される置換アミド化合物又はその塩、及びそれらを含む有害生物防除剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤を提供する。

明 細 書

置換アミド化合物及び有害生物防除剤

5 技術分野

本発明は、新規な置換アミド化合物及びその塩、並びに該化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤に関するものである。本発明における有害生物防除剤とは、農園芸分野、畜産分野及び衛生分野におけるあらゆる有害な生物を対象とした防除剤を意味する。また、本発明における農薬とは、農園芸分野における殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤を意味する。

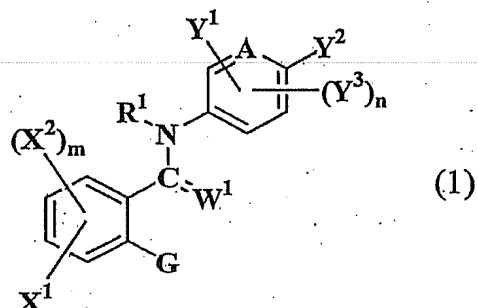
背景技術

- 従来、置換アミド誘導体に関しては、国際特許出願公報（WO 99/51580 号公報、WO 98/24771 号公報）に医薬品として用いられるサイトカイン産生阻害活性、パソプレッシン拮抗活性等を有することが開示されている。また、ヨーロッパ特許出願公報（EP 0, 919, 542 号公報、EP 1, 006, 107 号公報）、国際特許出願公報（WO 99/51580 号公報、WO 98/24771 号公報、WO 01/00575 号公報、WO 01/00599 号公報、WO 01/02354 号公報、WO 01/21576 号公報、WO 01/46124 号公報）には殺虫活性を有することが開示されている。しかしながら、本発明に係る新規な置換アミド誘導体に関しては何ら開示されていない。
- 20 有害生物防除剤、例えば殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来用いられてきた殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。また、既存の有害生物防除剤の一部のものは毒性が高く、或いはあるものは長期の残留性により、生態系を乱しつつある。このような状況下、低毒性かつ低残留性の新規な有害生物防除剤の開発が常に期待されている。
- 25 本発明者らは、上記の課題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、本発明に係る下記一般式（1）で表される新規な置換アミド化合物が優れた有害生物防除活性、特に殺虫殺ダニ活性を示し、且つ、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物であることを見出し、本発明を完成した。

発明の開示

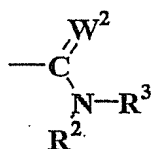
すなわち、本発明は下記〔1〕～〔12〕に関するものである。

〔1〕 一般式(1)：

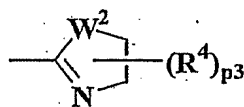


式中、Aは、炭素原子又は窒素原子を表し、

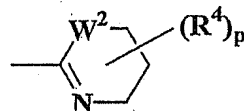
5 Gは、G-1、G-2又はG-3を表し、



G-1



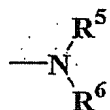
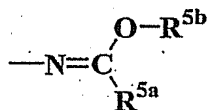
G-2



G-3

W¹及びW²は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

X¹は、X¹-1又はX¹-2を表し、

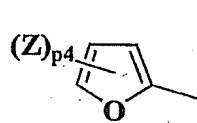
X¹-1X¹-2

X²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル又はC₁～C₆アルコキシカルボニルを表し、
10 mが2以上の整数を表すとき、各々のX²は互いに同一であっても、または相異なっているてもよく、

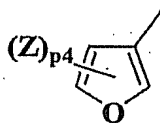
Y¹、Y²及びY³は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF₅、C₁～C₆アルキル、R⁷によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、R⁷によって任意に置換された(C₃～C₆)シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、
15

- R^7 によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、
 $-OH$ 、 $-OR^8$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)R^8$ 、 $-S(O)_2OR^{10}$ 、 $-S(O)_2NHR^{11}$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})R^{10}$ 、 $-NHR^9$ 、 $-N(R^9)R^8$ 、
 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、
 5 $-C(S)NHR^{11}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $-C(=NOR^{12})OR^{10}$ 、 $-C(=NOR^{12})SR^{10}$ 、
 $-C(=NOR^{12})NHR^{11}$ 、 $-C(=NOR^{12})N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $-P(O)(R^{14})(OR^{13})$ 、
 $-Si(R^{15})(R^{16})R^{14}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、 n が2以上の整数を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、
 10 更に Y^1 、 Y^2 及び Y^3 のうち、2つの Y が隣接する場合には、隣接する2つの Y は
 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R^{17})-$ 、
 $-CH_2N(R^{17})CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、
 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^{17})CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、
 $-N(R^{17})CH=N-$ 、 $-N(R^{17})N=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-OCH_2CH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHN=CH-$
 15 を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R^{18} によって任意に置換されていてもよく、

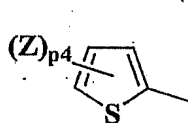
L は、式L-1から式L-58までの何れかで表される芳香族複素環を表し、



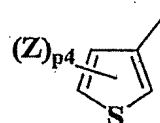
L-1



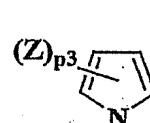
L-2



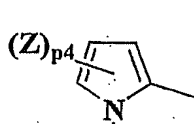
L-3



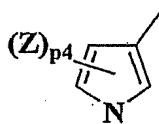
L-4



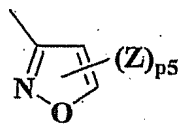
L-5



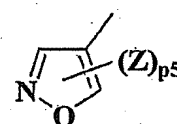
L-6



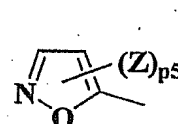
L-7



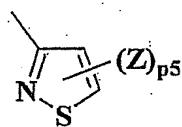
L-8



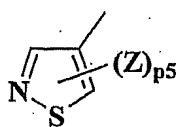
L-9



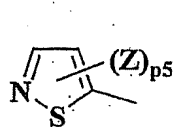
L-10



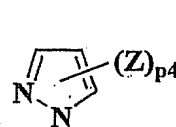
L-11



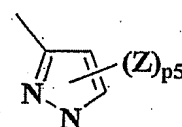
L-12



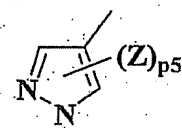
L-13



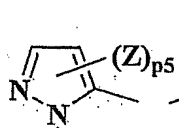
L-14



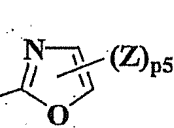
L-15



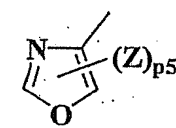
L-16



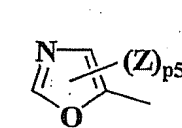
L-17



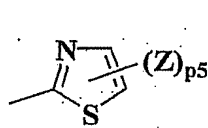
L-18



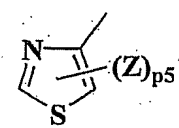
L-19



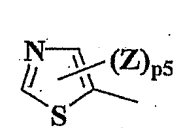
L-20



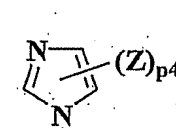
L-21



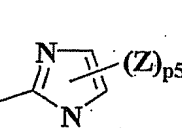
L-22



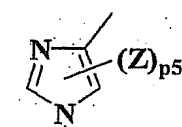
L-23



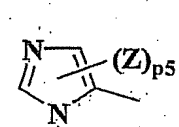
L-24



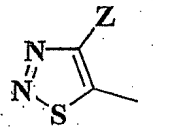
L-25



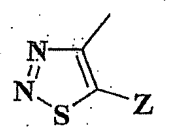
L-26



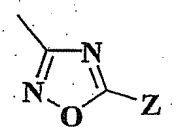
L-27



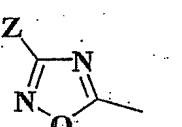
L-28



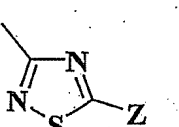
L-29



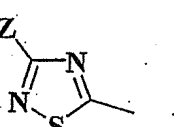
L-30



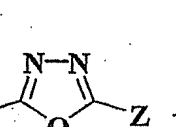
L-31



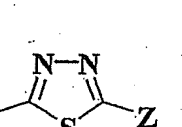
L-32



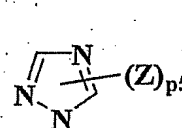
L-33



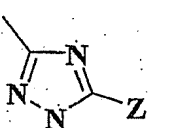
L-34



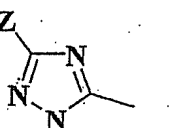
L-35



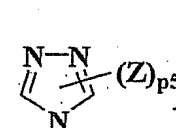
L-36



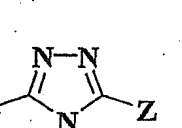
L-37



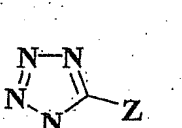
L-38



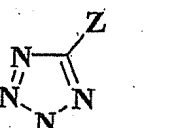
L-39



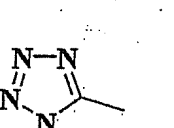
L-40



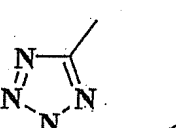
L-41



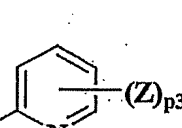
L-42



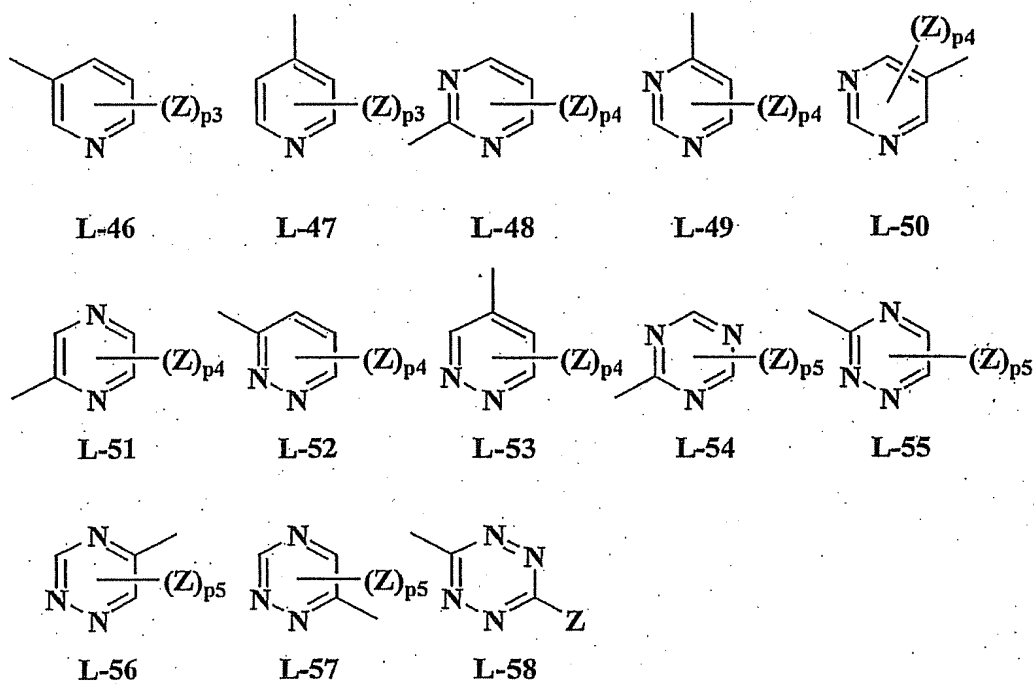
L-43



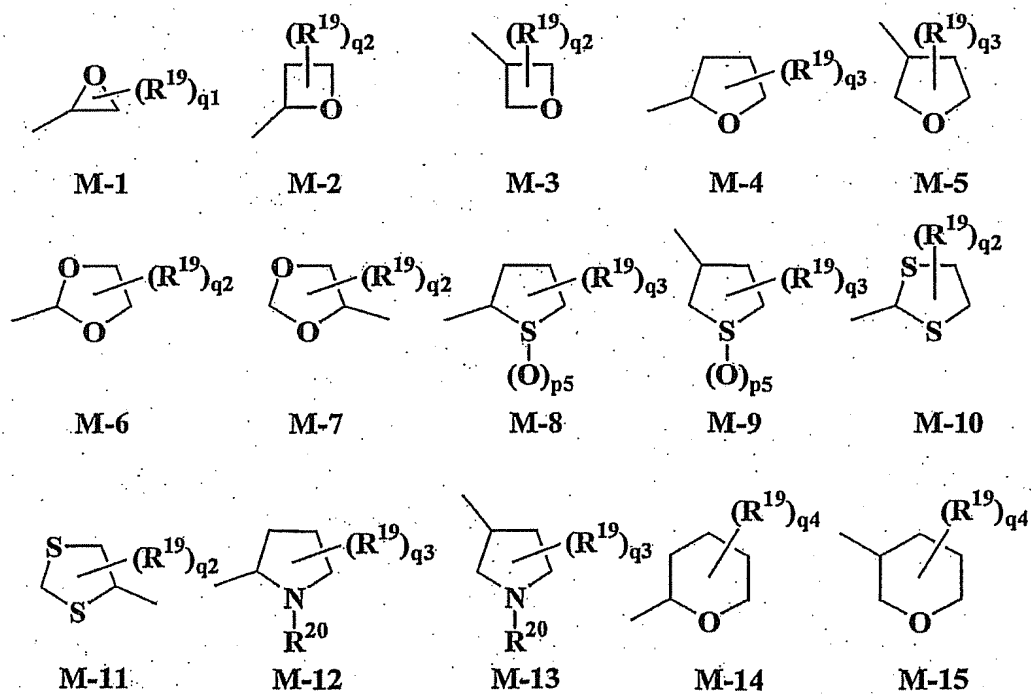
L-44

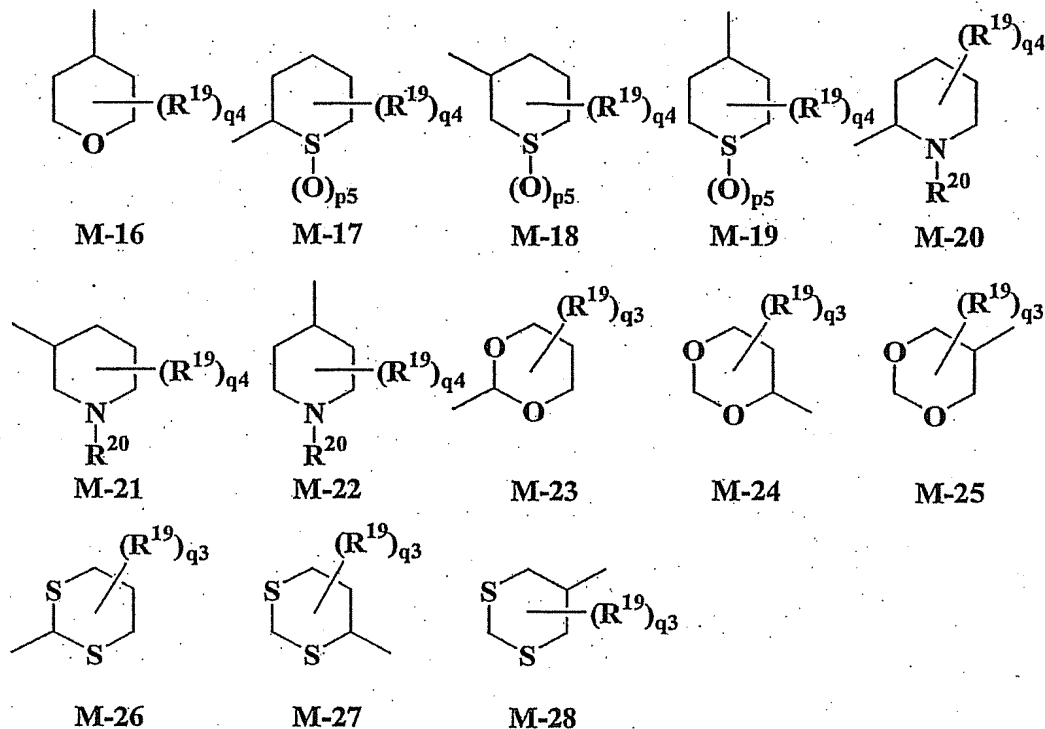


L-45



M は、式 M-1 から式 M-28 までの何れかで表される脂肪族複素環を表し、





Z は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又はフェニルを表し、p1, p2, p3, p4, p5 又は p6 が 2 以上の整数を表すとき、各々の Z は互いに同一であっても、または相異なっているとき、

- 10 R^1 , R^2 及び R^3 は、各々独立して水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルキニル、 $-OR^{22}$ 、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、
 15 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 、 $-N(R^{23})R^{22}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{28})R^{27}$ 、
 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 又は M を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレ

ン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

- 5 R^4 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1\sim C_{10}$) アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3\sim C_6$) シクロアルキル、 $C_2\sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_2\sim C_{10}$) アルケニル、 $C_2\sim C_8$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_2\sim C_{10}$) アルキニル、 $-OH$ 、 $-OR^8$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2R^{29}$ 、 $-NHR^9$ 、 $-N(R^9)R^8$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、
 10 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $-P(\text{フェニル})_2$ 、 $-P(O)(\text{フェニル})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 $(Z)_{p6}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 L 又は M を表し、 p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、
- 15 R^5 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1\sim C_6$) アルキル、 $C_2\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって
 20 置換されていてもよいフェニルを表し、
 R^{5a} は、水素原子、 $C_1\sim C_5$ アルキル、 $C_1\sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル ($C_1\sim C_3$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ ($C_1\sim C_3$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ ($C_1\sim C_3$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1\sim C_3$) アルキル、 $L-(C_1\sim C_3)$ アルキル、 $M-(C_1\sim C_3)$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、
 25 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、
 R^{5b} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル又は $C_3\sim C_6$ アルキニルを表し、
 R^6 は、(i) A が炭素原子を表すとき、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置

- 換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、
- さらに或いは、 R^6 が R^2 と一緒になって $-C(R^{6a})(R^{6b})-$ 又は $-C(O)C(R^{6a})(R^{6b})-$ を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成してもよいことを表し、
- (ii) A が窒素原子を表すとき、 R^6 は R^2 と一緒になって $-C(R^{6a})(R^{6b})-$ 又は $-C(O)C(R^{6a})(R^{6b})-$ を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成することを表し、
- 15 R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表すか、或いは、 R^{6a} と R^{6b} とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する炭素原子と共に 3 ～ 6 員環を形成しても
- 20 よいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、
- R^7 は、ハロゲン原子、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、
- 25 $-OR^8$ 、 $-ON=C(R^{11})R^{10}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)R^8$ 、 $-NHR^9$ 、 $-N(R^9)R^8$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $-Si(R^{15})(R^{16})R^{14}$ 、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2} によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、
- R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30}

によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)NHR^{11}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2NHR^{11}$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換

5 されていてよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてよいフェノキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていて

15 もよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてよいナフチル、 L 又は M を表すか、或いは、 R^8 と R^9 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基によって置換されていてもよく、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、トリメチルシリル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $L-(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $M-(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてよいナフチル、 L

25

又はMを表し、

R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル基によって置換されていてもよく、

R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、L-($C_1 \sim C_4$)アルキル、M-($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{15} 及び R^{16} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{18} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$

アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2} によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、同時に2個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっているてもよく、

R^{19} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、q1, q2, q3 又は q4 が2以上の整数を表すとき、各々の R^{19} は互いに同一であっても、または相異なっているてもよく、

R^{20} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$)アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノチオカルボニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルスルホニル、-P(O)(OR¹³)₂ 又は -P(S)(OR¹³)₂ を表し、

R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、-OH、-OR⁸、-SH、-S(O)_pR²⁹、-NHR⁹、-N(R⁹)R⁸、-CHO、-C(O)R¹⁰、-C(O)OH、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)NHR¹¹、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(O)C(O)OR¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂、-P(フェニル)₂、-P(O)(フェニル)₂、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2}によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、

R^{22} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

12

R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^{25} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5 ～ 8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジルオキシ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5 ～ 8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫

黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

5 R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、 $-SH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)R^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)NHR^{11}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^{30} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2R^{32}$ 、 $-NHR^{33}$ 、 $-N(R^{33})R^{32}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{34}$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OR^{34}$ 、 $-C(R^{34})=NOR^{12}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

15 R^{31} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2R^{32}$ 、 $-NHR^{33}$ 、 $-N(R^{33})R^{32}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $-P(\text{フェニル})_2$ 、 $-P(O)(\text{フェニル})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

20 R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノチオカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

14

R^{33} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表すか、或いは、 R^{32} と R^{33} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ
10 ハロゲン原子又はメチル基によって置換されていてもよく、

R^{34} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、
15

m は、1 ～ 3 の整数を表し、
 n は、1 ～ 3 の整数を表し、
 p は、1 ～ 6 の整数を表し、
20 $p1$ は、1 ～ 5 の整数を表し、
 $p2$ は、1 ～ 7 の整数を表し、
 $p3$ は、1 ～ 4 の整数を表し、
 $p4$ は、1 ～ 3 の整数を表し、
 $p5$ は、1 ～ 2 の整数を表し、
25 $p6$ は、1 ～ 9 の整数を表し、
 $q1$ は、0 ～ 3 の整数を表し、
 $q2$ は、0 ～ 5 の整数を表し、
 $q3$ は、0 ～ 7 の整数を表し、
 $q4$ は、0 ～ 9 の整数を表し、

r は、0～2の整数を表す、

で表される置換アミド化合物又はその塩から選ばれる1種及び2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

〔2〕 上記〔1〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

〔3〕 上記〔1〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。

〔4〕 上記〔1〕記載の一般式（1）で表される化合物において、

A は、炭素原子を表し、

- 10 Y¹、Y²及びY³は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF₅、C₁～C₆アルキル、R⁷によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、R⁷によって任意に置換された(C₃～C₆)シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、R⁷によって任意に置換された(C₂～C₆)アルケニル、C₃～C₈シクロアルケニル、C₃～C₈ハロシクロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、R⁷によって任意に置換された(C₂～C₆)アルキニル、
- 15 -OH、-OR⁸、-SH、-S(O)_rR⁸、-S(O)₂OR¹⁰、-S(O)₂NHR¹¹、-S(O)₂N(R¹¹)R¹⁰、-NHR⁹、-N(R⁹)R⁸、-CHO、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)NHR¹¹、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)NHR¹¹、-C(S)N(R¹¹)R¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、-C(=NOR¹²)OR¹⁰、-C(=NOR¹²)SR¹⁰、-C(=NOR¹²)NH(R¹¹)、-C(=NOR¹²)N(R¹¹)R¹⁰、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂、-P(O)(R¹⁴)(OR¹³)、-Si(R¹⁵)(R¹⁶)R¹⁴、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2}によって置換されていてもよいナフチル、L-1～L-13、L-15～L-35、L-37～L-58 又はMを表し、nが2以上の整数を表すとき、各々のYは互いに同一であっても、または相異なっているてもよく、
- 20 更に、nが2以上の整数であり、且つ2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのYは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N(R¹⁷)-, -CH₂N(R¹⁷)CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-,
- 25 -CH₂CH=CH-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N(R¹⁷)CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N(R¹⁷)CH=N-, -N(R¹⁷)N=CH-, -CH=CHCH=CH-, -OCH₂CH=CH-, -N=CHCH=CH-又は-N=CHN=CH-を形成することにより、それぞれのYが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はR¹⁸によって任意に置換されていてもよく、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

16

R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよい置換アミド化合物又はその塩。

10 〔5〕 上記〔1〕記載の一般式（1）で表される化合物において、

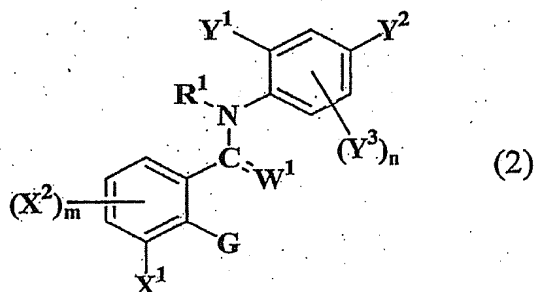
A は、炭素原子又は窒素原子を表し、

G は、G-1 を表し、

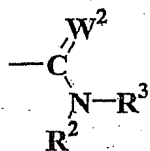
X^1 は、 X^1-1 を表し、

15 R^2 は R^6 と一緒になって $-C(R^{6a})(R^{6b})-$ 又は $-C(O)C(R^{6a})(R^{6b})-$ を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成することを表す置換アミド化合物又はその塩。

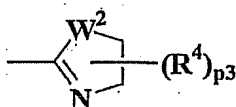
〔6〕 一般式（2）：



式中、G は、G-1 又は G-2 を表し、



G-1



G-2

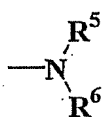
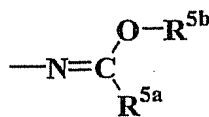
W^1 及び W^2 は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

20 X^1 は、 X^1-1 又は X^1-2 を表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

17

 X^1-1  X^1-2

X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル又は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

- 5 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルコキシ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルチオ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルチオ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($\text{C}_1\sim\text{C}_6$)アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニルオキシ、
10 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニルオキシ、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニルチオ、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニルチオ、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルアミノ、ジ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル)アミノ、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、
15 $-\text{Si}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})\text{R}^{14}$ 、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-51、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、

- Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された($\text{C}_1\sim\text{C}_6$)アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された($\text{C}_3\sim\text{C}_8$)シクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 R^7 によって任意に置換された($\text{C}_2\sim\text{C}_6$)アルケニル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ ハロシクロアルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された($\text{C}_2\sim\text{C}_6$)アルキニル、 $-\text{OR}^{8a}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{8a}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)\text{R}^{8b}$ 、
20 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{13})_2$ 、 $-\text{P}(\text{S})(\text{OR}^{13})_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})\text{R}^{14}$ 、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-58 又は M を表し、

- 25 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $-\text{O}-$ (L-17)、 $-\text{O}-$ (L-45)、 $-\text{O}-$ (L-48)、 $\text{C}_1\sim$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

18

C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、
-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-51、M-1、M-6、M-10、M-23
又はM-26を表し、nが2又は3を表すとき、各々のY³は互いに同一であっても、又は相
5 異なっているてもよく、

さらに、Y³がY¹又はY²と隣接する場合には、隣接する2つのY¹とY³又はY²とY³は
-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N(R¹⁷)-,
-CH₂N(R¹⁷)CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-,
-OCH₂CH₂S-, -OCH=N-, -SCH=N-又は-N(R¹⁷)CH=N-を形成することにより、それぞれのY¹及
10 びY³又はY²及びY³が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよいことを
表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はR¹⁸によって任意に
置換されているてもよく、

R¹及びR²は、各々独立して水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₄ア
ルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄ハロアルキルチ
15 オ(C₁~C₄)アルキル、(Z)_{p1}によって置換されているてもよいフェニルチオ(C₁~C₄)アルキル、
C₁~C₄アルキルスルホニル(C₁~C₄)アルキル、C₂~C₆シアノアルキル、C₁~C₆アルコキシカル
ルボニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、
C₃~C₆ハロアルキニル、-OH、C₁~C₆アルコキシ、-SR²⁴、-S(O)₂R²⁴、-SN(R²⁶)R²⁵、C₁~C₆ア
ルキルカルボニル又はC₁~C₆アルコキシカルボニルを表し、

20 R³は、C₁~C₈アルキル、R²¹によって任意に置換された(C₁~C₈)アルキル、C₃~C₈シクロ
アルキル、ヒドロキシ(C₃~C₈)シクロアルキル、C₁~C₄アルコキシ(C₃~C₈)シクロアルキル、
C₁~C₄アルキルチオ(C₃~C₈)シクロアルキル、C₁~C₄アルキルスルフィニル(C₃~C₈)シクロ
アルキル、C₁~C₄アルキルスルホニル(C₃~C₈)シクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆
ハロアルケニル、(Z)_{p1}によって置換されているてもよいフェニル(C₃~C₈)アルケニル、L-
25 (C₃~C₈)アルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、(Z)_{p1}によって置換され
ているてもよいフェニル(C₃~C₈)アルキニル、L-(C₃~C₈)アルキニル、-OR²²、-N(R²³)R²²、L
又はMを表すか、或いは、R²とR³とが一緒になってC₂~C₆アルキレン鎖を形成すること
により、結合する窒素原子と共に3~7員環を形成してもよいことを表し、このときこ
のアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでも

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

19

よく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された($C_2 \sim C_{10}$)アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された($C_2 \sim C_{10}$)アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p0}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 L 又は M を表し、 p が2以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 L -($C_1 \sim C_4$)アルキル、 M -($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{26})R^{27}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{5b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコシカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

20

R^7 は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニ
 ルオキシ、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニ
 ルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1\sim C_4$)アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシカル
 ボニル($C_1\sim C_4$)アルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1\sim C_4$)アルコ
 5 キシ、 $-ON=C(R^{11})R^{10}$ 、 $-O-(L-18)$ 、 $-O-(L-21)$ 、 $-O-(L-25)$ 、 $-O-(L-45)$ 、 $-O-(L-48)$ 、 $-O-$
 $(L-49)$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、
 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスル
 ホニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル又は L を表し、

R^{8a} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1\sim C_6$)アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロ
 10 アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3\sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 R^{30}
 によって任意に置換された($C_2\sim C_6$)アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置
 換された($C_2\sim C_6$)アルキニル、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、
 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $L-17$ 、 $L-18$ 、 $L-21$ 、 $L-25$ 、
 $L-45$ 、 $L-48$ 又は $L-49$ を表し、

15 R^{8b} は、 $-C(O)R^{10}$ 又は $-C(O)OR^{10}$ を表し、

R^9 は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキル表し、

R^{10} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル($C_1\sim C_4$)アルキル、
 $C_1\sim C_6$ アルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ アル
 キルチオ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルス
 20 ルホニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_2\sim C_6$ シア
 ノアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1\sim C_4$)アルキル、トリメチルシリル($C_1\sim C_4$)ア
 ルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $L-(C_1\sim C_4)$ アル
 キル、 $M-(C_1\sim C_4)$ アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ ア
 ルケニル($C_3\sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル($C_3\sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$
 25 アルケニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{p1}$ に
 によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L
 又は M を表し、

R^{11} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3\sim C_8$ シクロアルキルを表
 すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2\sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

21

合する窒素原子と共に 3～6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

5 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

10 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

15 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

20 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、-OH、-OR^{8c}、-SH、-S(O)₁R²⁹、-N(R⁹)R^{8c}、-CHO、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

25 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(S)N(R¹¹)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-S(O)₂N(R¹¹)R¹⁰、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂ 又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{22} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル (C_1

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

22

～C₄) アルキルを表し、

R²³ は、水素原子、C₁～C₆ アルキル、-CHO、C₁～C₆ アルキルカルボニル、C₁～C₆ アルコキシカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル (C₁～C₄) アルコキシカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

R²⁴ は、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ ハロアルキル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R²⁵ は、C₁～C₁₂ アルキル、C₁～C₆ アルコキシカルボニル (C₁～C₄) アルキル又は C₁～C₁₂ アルコキシカルボニルを表し、

10 R²⁶ は、C₁～C₁₂ アルキル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル (C₁～C₄) アルキルを表すか、或いは、R²⁵ と R²⁶ とが一緒になって C₄～C₇ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5～8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ C₁～C₄ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

15 R²⁷ は、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ ハロアルキル、C₁～C₆ アルコキシ (C₁～C₄) アルキル、C₂～C₆ シアノアルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいベンジル、C₃～C₈ シクロアルキル、C₃～C₆ アルケニル、C₃～C₆ アルキニル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

20 R²⁸ は、水素原子又は C₁～C₆ アルキルを表すか、或いは、R²⁷ と R²⁸ とが一緒になって C₄～C₇ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5～8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ C₁～C₄ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

25 R²⁹ は、C₁～C₈ アルキル、R³¹ によって任意に置換された (C₁～C₆) アルキル、C₃～C₈ シクロアルキル、R³¹ によって任意に置換された (C₃～C₆) シクロアルキル、C₃～C₆ アルケニル、C₃～C₆ ハロアルケニル、C₃～C₆ アルキニル、C₃～C₆ ハロアルキニル、C₁～C₆ アルキルチオ、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルチオ、-C(O)R¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(S)N(R¹¹)R¹⁰、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L-18、L-21、L-25、L-30、L-31、L-32、L-33、L-34、L-35、L-37、L-38、L-40、L-

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

23

45、L-48 又は L-49 を表し、

R^{30} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

5 R^{31} は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-S(O)R^{32}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、

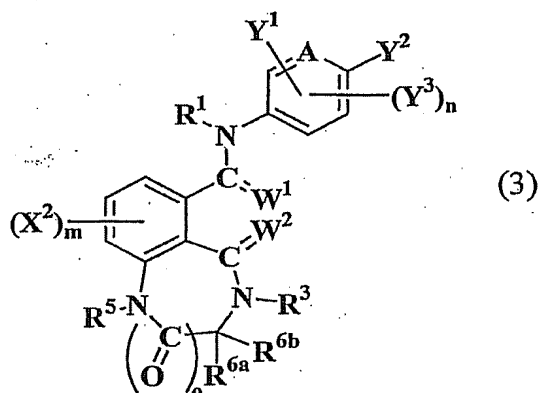
10 m は、1～3の整数を表し、

n は、1～3の整数を表し、

p は、1～4の整数を表す、

で表される上記〔4〕記載の置換アミド化合物又はその塩。

〔7〕 一般式 (3) :



15 式中、A は、炭素原子又は窒素原子を表し、

W^1 及び W^2 は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

20

Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

24

キシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})\text{R}^{14}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、

Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^7 によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、 $-\text{OR}^{8a}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{8a}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)\text{R}^{8b}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{13})_2$ 、 $-\text{P}(\text{S})(\text{OR}^{13})_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})\text{R}^{14}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-\text{O}-(\text{L}-17)$ 、 $-\text{O}-(\text{L}-45)$ 、 $-\text{O}-(\text{L}-48)$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、L、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、 n が 2 又は 3 を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なってもよく、

さらに Y^1 、 Y^2 及び Y^3 のうち、何れか 2 つが隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{17})-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}=\text{N}-$ を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

25

を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R^{18} によって任意に置換されていてもよく、

R^1 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、
 5 (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2 R^{24}$ 、 $-SN(R^{26}) R^{25}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

10 R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ヒドロキシ ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_3 \sim C_6$) アルケニル、L-
 15 ($C_3 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、L-($C_3 \sim C_6$) アルキニル、 $-OR^{22}$ 、 $-N(R^{23}) R^{22}$ 、L 又は M を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでも
 20 よく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、
 25 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、L-($C_1 \sim C_4$) アルキル、M-($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカル

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

26

ボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

- R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_2\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1\sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表すか、或いは、 R^{6a} と R^{6b} とが一緒になって $C_2\sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する炭素原子と共に 3～6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且
- 15 つハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

- R^7 は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1\sim C_4$) アルコキシ、 $-ON=C(R^{11})R^{10}$ 、 $-O-(L-18)$ 、 $-O-(L-21)$ 、 $-O-(L-25)$ 、 $-O-(L-45)$ 、 $-O-(L-48)$ 、 $-O-(L-49)$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル又は L を表し、
- 25

R^{8a} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_1\sim C_6$) アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_2\sim C_6$) アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_2\sim C_6$) アルキニル、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

27

-P(S)(OR¹³)₂, (Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、L-17、L-18、L-21、L-25、L-45、L-48又はL-49を表し、

R^{8b}は、-C(O)R¹⁰又は-C(O)OR¹⁰を表し、

R⁹は、水素原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキル表し、

- 5 R¹⁰は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆ハロアルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆ハロアルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルキルスルホニル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル(C₁~C₄)アルキル、C₂~C₆シアノアルキル、C₁~C₆アルコキシカルボニル(C₁~C₄)アルキル、トリメチルシリル(C₁~C₄)アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル(C₁~C₄)アルキル、L-(C₁~C₄)アルキル、M-(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₂~C₆アルケニル(C₃~C₈)シクロアルキル、C₂~C₆ハロアルケニル(C₃~C₈)シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2}によって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、
- 10
- 15

R¹¹は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₃~C₈シクロアルキルを表すか、或いは、R¹⁰とR¹¹とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つC₁~C₆アルキル基又はC₁~C₆アルコキシ基によって置換されていてもよく、

20

- R¹²は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルコキシカルボニル(C₁~C₄)アルキル、ジ(C₁~C₄アルキル)アミノカルボニル(C₁~C₄)アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル又はC₃~C₆アルキニルを表し、
- 25

R¹³は、C₁~C₆アルキルを表し、

R¹⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

28

し、

R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に2個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっているとしてもよく、

R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{8c}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2R^{29}$ 、 $-N(R^9)R^{8c}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表し、

R^{8c} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ($C_1\sim C_4$)アルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{22} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1\sim C_4$)アルキルを表し、

R^{23} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-CHO$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1\sim C_4$)アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

R^{24} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{25} は、 $C_1\sim C_{12}$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1\sim C_4$)アルキル又は $C_1\sim C_{12}$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{26} は、 $C_1\sim C_{12}$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1\sim C_4$)アルキルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4\sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に5～8員環を形成してもよいことを表し、このときこの

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

29

アルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、
5 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5 ～ 8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる
10 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、
15 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-18、L-21、L-25、L-30、L-31、L-32、L-33、L-34、L-35、L-37、L-38、L-40、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

R^{30} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、
20

R^{31} は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-S(O)R^{32}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、
25

m は、1 ～ 3 の整数を表し、

n は、1 ～ 3 の整数を表し、

o は、0 又は 1 の整数を表す、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

30

で表される上記〔5〕記載の置換アミド化合物又はその塩。

〔8〕 W^1 及び W^2 は、酸素原子を表し、

- X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はトリフルオロメタンスルホニルを表し、 m が 2 以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なっているとき、

- Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオを表し、

- Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $-O-$ (L-17)、 $-O-$ (L-45)、 $-O-$ (L-48)、 $-O-$ (L-49)、 $C_1 \sim C_6$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

31

アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換
 されていてもよいフェニルチオ、 $-S-(L-17)$ 、 $-S-(L-45)$ 、 $-S-(L-48)$ 、 $-S-(L-49)$ 、 $C_1 \sim C_6$
 ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルス
 ルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、 $-N(R^9)R^{8b}$ 、 $-Si(CH_3)_2R^{14}$ 、 $L-1 \sim L-13$ 、 $L-15$
 5 $\sim L-35$ 、 $L-37 \sim L-58$ 又は M を表し、

Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ
 ル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ
 ルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキ
 ルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 n が 2 又は 3 を表すとき、各々
 10 の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なってもよく、

さらに、 Y^3 が Y^1 又は Y^2 と隣接する場合には、隣接する 2 つの Y^1 と Y^3 又は Y^2 と Y^3 は
 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、
 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 又は $-N(R^{17})CH=N-$ を形成すること
 により、それぞれの Y^1 及び Y^3 又は Y^2 及び Y^3 が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環
 15 を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素
 原子は R^{18} によって任意に置換されていてもよく、

R^1 は、水素原子を表し、

R^2 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロ
 20 アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル ($C_3 \sim C_8$)
 シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケ
 ニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_6$)アルキニ
 ル、 $(L-3)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-4)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-45)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、
 $(L-46)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $M-3$ 、 $M-5$ 、
 25 $M-9$ 、 $M-13$ 、 $M-15$ 、 $M-16$ 、 $M-18$ 、 $M-19$ 、 $M-21$ 、 $M-22$ 、 $M-25$ 又は $M-28$ を表すか、或いは、
 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子
 と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、
 硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メ
 チル基又はメトキシ基によって置換されていてもよく、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

32

R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、 p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異なっているとしてもよく、

R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、
5 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $L-$ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $M-$ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロ
10 アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノスルホニル、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 又は $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ を表し、

15 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

20 R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっているとしてもよく、

25 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{8c}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2R^{29}$ 、 $-N(R^9)R^{8c}$ 、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表し、

R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

33

C_6 アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

- 5 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

- R^{11} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基によって置換されていてもよく、

- R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、
15 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_3 \sim C_6$ アルケニルを表し、

- R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、
20 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

- R^{31} は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表す上記〔6〕記載の置換アミド化合物又はその塩。

〔9〕 W^1 及び W^2 は、酸素原子を表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

34

X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、プロモジフルオロメトキシ、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はトリフルオロメタンスルホニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに
5 同一であっても、または相異なっているいてもよく、

Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されて
10 いてもよいフェニルチオを表し、

Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されて
20 いてもよいベンジルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $-O-$ (L-17)、 $-O-$ (L-45)、 $-O-$ (L-48)、 $-O-$ (L-49)、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-S-$ (L-17)、 $-S-$ (L-45)、 $-S-$ (L-48)、 $-S-$ (L-49)、 $C_1 \sim C_6$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

35

ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、 $-N(R^9)R^{9b}$ 、 $-Si(CH_3)_2R^{14}$ 、 L 又は M を表し、

Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 n が 2 又は 3 を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なっているともよく、

さらに Y^1 、 Y^2 及び Y^3 のうち、何れか 2 つが隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、
 10 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 又は $-N(R^{17})CH=N-$ を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R^{18} によって任意に置換されていてもよく、

R^1 は、水素原子を表し、

15 R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル ($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_6$)アルキニル、 $(L-3)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-4)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-45)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、
 20 $(L-46)-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $M-3$ 、 $M-5$ 、 $M-9$ 、 $M-13$ 、 $M-15$ 、 $M-16$ 、 $M-18$ 、 $M-19$ 、 $M-21$ 、 $M-22$ 、 $M-25$ 又は $M-28$ を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メ
 25 チル基又はメトキシ基によって置換されていてもよく、

R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$)アルキル、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

36

ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、L- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、M- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルチオ、

5 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルスルホニル、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノスルホニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニルを表し、

R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

10 R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に2個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

15 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{8c}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)R^{29}$ 、 $-N(R^9)R^{8c}$ 、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

20 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

25 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

R^{11} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって C_2

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

37

～C₆アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つC₁～C₆アルキル基によって置換されていてもよく、

R¹²は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル(C₁～C₄)アルキル、C₁～C₄アルコキシ(C₁～C₄)アルキル、C₁～C₄アルキルチオ(C₁～C₄)アルキル、C₁～C₄アルコキシカルボニル(C₁～C₄)アルキル、ジ(C₁～C₄アルキル)アミノカルボニル(C₁～C₄)アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル(C₁～C₄)アルキル又はC₃～C₆アルケニルを表し、

R²⁹は、C₁～C₆アルキル、R³¹によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₁～C₆アルキルチオ、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルチオ、-C(O)R¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(S)N(R¹¹)R¹⁰、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45、L-48又はL-49を表し、

R³¹は、ハロゲン原子、-OH、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、C₁～C₆ハロアルキルカルボニルオキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノカルボニル又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表す上記〔7〕記載の置換アミド化合物又はその塩。

〔10〕 上記〔4〕ないし〔9〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

〔11〕 上記〔4〕ないし〔9〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

〔12〕 上記〔4〕ないし〔9〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。

発明を実施するための最良の形態

本発明に包含される化合物には、置換基の種類によってはE-体及びZ-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれらE-体、Z-体又はE-体及びZ-体を任意の割合で

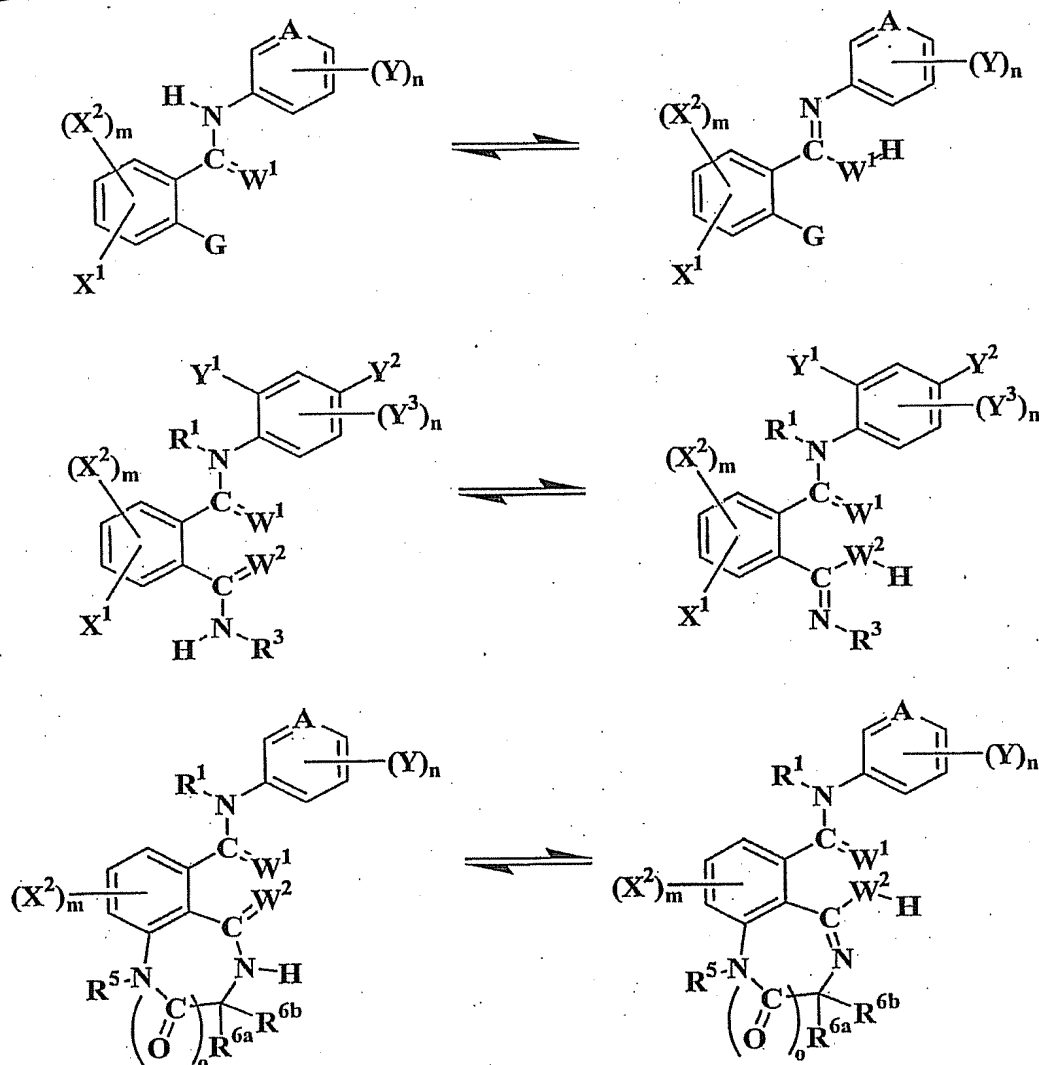
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

38

含む混合物を包含するものである。また、本発明に包含される化合物のうちには、1個又は2個以上の不斉炭素原子の存在に起因する光学活性体が存在する場合があるが、本発明は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。さらに、本発明化合物は R^1 、 R^2 或いは R^3 が水素原子であるときに、場合によっては次式で表される互変異性体の存在が考えられるが、本発明はそれらの構造をも包含するものである。

5



本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って酸付加塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、リン酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、酒

10

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

39

石酸、蔞酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩又はグルタミン酸、アスパラギン酸等のアミノ酸の塩とすることができる。

5 或いは、本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って金属塩にすることができるものは、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウムの塩とすることができる。

10 次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、n-はノルマル、i-はイソ、s-はセカンダリー及びt-はターシャリーを各々意味し、Phはフェニルを意味する。

本発明化合物におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

15 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、例えばメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、1-エチルプロピル基、1,1-ジメチルプロピル基、1,2-ジメチルプロピル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、1-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、1-エチルブチル基、2-エチルブチル基、1,1-ジメチルブチル基、1,2-ジメチルブチル基、1,3-ジメチルブチル基、2,2-ジメチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、3,3-ジメチルブチル基、1,1,2-トリメチルプロピル基、1,2,2-トリメチルプロピル基、1-エチル-1-メチルプロピル基、1-エチル-2-メチルプロピル基、ヘプチル基、1-メチルヘキシル基、5-メチルヘキシル基、1,1-ジメチルペンチル基、2,2-ジメチルペンチル基、4,4-ジメチルペンチル基、1-エチルペンチル基、2-エチルペンチル基、1,1,3-トリメチルブチル基、1,2,2-トリメチルブチル基、1,3,3-トリメチルブチル基、2,2,3-トリメチルブチル基、2,3,3-トリメチルブチル基、1-n-プロピルブチル基、1,1,2,2-テトラメチルプロピル基、オクチル基、1-メチルヘプチル基、3-メチルヘプチル基、6-メチルヘプチル基、2-エチルヘキシル基、5,5-ジメチルヘキシル基、2,4,4-トリメチルペンチル基、1-エチル-1-メチルペンチル基、

25

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

40

ノニル基、1-メチルオクチル基、2-メチルオクチル基、3-メチルオクチル基、7-メチルオクチル基、1-エチルヘプチル基、1,1-ジメチルヘプチル基、6,6-ジメチルヘプチル基、デシル基、1-メチルノニル基、2-メチルノニル基、6-メチルノニル基、1-エチルオクチル基、1-n-プロピルヘプチル基、ウンデシル基、1-メチルデシル基、2-メチルデシル基、8-メチルデシル基、1-エチルノニル基、1-n-プロピルオクチル基、1-n-ブチルヘプチル基、ドデシル基、1-メチルウンデシル基、3-メチルウンデシル基、9-メチルウンデシル基、10-メチルウンデシル基、1-エチルデシル基、1-n-プロピルノニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっている場合、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブromोजフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、1-クロロエチル基、2-クロロエチル基、1-ブromoエチル基、2-ブromoエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、1,2-ジクロロエチル基、2,2-ジクロロエチル基、2-ブromo-2-クロロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、2,2,2-トリクロロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチル基、2-ブromo-1,1,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、1-クロロ-1,2,2,2-テトラフルオロエチル基、2-ブromo-1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、2,2-ジクロロ-1,1,2-トリフルオロエチル基、2,2,2-トリクロロ-1,1-ジフルオロエチル基、2-フルオロ-1-メチルエチル基、1-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロ-1-メチルエチル基、2-ブromoプロピル基、3-ブromoプロピル基、2-ブromo-1-メチルエチル基、3-ヨードプロピル基、2,3-ジクロロプロピル基、2,3-ジブromoプロピル基、3,3,3-トリフルオロプロピル基、3,3,3-トリクロロプロピル基、3-ブromo-3,3-ジフルオロプロピル基、3,3-ジクロロ-3-フルオロプロピル基、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル基、1-ブromo-3,3,3-トリフルオロプロピル基、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル基、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル基、2,2,2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

41

- チル基、ヘプタフルオロプロピル基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル基、2-プロモ-1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピル基、2, 3-ジクロロ-1, 1, 2, 3, 3-ペンタフルオロプロピル基、2-クロロブチル基、3-クロロブチル基、4-クロロブチル基、2-クロロ-1, 1-ジメチルエチル基、4-プロモブチル基、3-プロモ-2-メチルプロピル基、
- 5 2-プロモ-1, 1-ジメチルエチル基、2, 2-ジクロロ-1, 1-ジメチルエチル基、2-クロロ-1-クロロメチル-2-メチルエチル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、3, 3, 3-トリフルオロ-1-メチルプロピル基、3, 3, 3-トリフルオロ-2-メチルプロピル基、2, 3, 4-トリクロロブチル基、2, 2, 2-トリクロロ-1, 1-ジメチルエチル基、4-クロロ-4, 4-ジフルオロブチル基、4, 4-ジクロロ-4-フルオロブチル基、4-プロモ-4, 4-ジフルオロブチル基、2, 4-ジプロモ-
- 10 4, 4-ジフルオロブチル基、3, 4-ジクロロ-3, 4, 4-トリフルオロブチル基、3, 3-ジクロロ-4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4-プロモ-3, 3, 4, 4-テトラフルオロブチル基、4-プロモ-3-クロロ-3, 4, 4-トリフルオロブチル基、2, 2, 3, 3, 4, 4-ヘキサフルオロブチル基、2, 2, 3, 4, 4-ヘキサフルオロブチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチル-1-トリフルオロメチルエチル基、3, 3, 3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル基、
- 15 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロブチル基、2, 3, 3, 3-テトラフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-オクタフルオロブチル基、ノナフルオロブチル基、4-クロロ-1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-オクタフルオロブチル基、5-クロロペンチル基、3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル基、5-プロモペンチル基、1, 5-ジプロモペンチル基、2, 3-ジプロモ-1, 1-ジメチルプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロ-2-メチルブチル基、4, 4, 5, 5, 5-ペン-
- 20 タフルオロペンチル基、5-プロモ-4, 4, 5, 5-テトラフルオロペンチル基、4, 4-ジクロロ-5, 5, 5-トリフルオロペンチル基、4, 5-ジクロロ-4, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-プロモ-4-クロロ-4, 5, 5-トリフルオロペンチル基、4, 4, 4-トリフルオロ-4-トリフルオロメチルブチル基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘプタフルオロペンチル基、3, 4, 4, 4-テトラフルオロ-3-トリフルオロメチルブチル基、2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘキサフルオロ-2-トリフルオロメチルブチル
- 25 基、2, 4, 5-トリクロロ-1, 1, 2, 3, 3, 4, 5, 5-オクタフルオロペンチル基、6-クロロヘキシル基、6-プロモヘキシル基、4, 4-ジクロロ-2, 2-ジメチルブチル基、4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ヘプタフルオロヘキシル基、4, 5, 5, 5-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチルペンチル基、3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘキサフルオロ-3-トリフルオロメチルペンチル基、4, 4, 4-トリフルオロ-3, 3-ビストリフルオロメチルブチル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6-ドデカフルオロヘキ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

42

シル基、トリデカフルオロヘキシル基、6-クロロ-1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6-ドデカフル
 オロヘキシル基、7-ブromoヘプチル基、4, 5, 5, 6, 6, 6-ヘキサフルオロ-4-トリフルオロメ
 チルヘキシル基、5, 5, 5-トリフルオロ-4, 4-ビストリフルオロメチルペンチル基、ペンタ
 5 デカフルオロヘプチル基、8-クロロオクチル基、8-ブromoオクチル基、7, 7, 8, 8, 8-ペン
 タフルオロオクチル基、9-ブromoノニル基、9, 9, 9-トリフルオロノニル基、7, 8, 8, 8-テ
 トラフルオロ-7-トリフルオロメチルオクチル基、10-クロロデシル基、10-ブromoデシル
 基、11-ブromoウンデシル基、11, 11, 11-トリフルオロウンデシル基、12-ブromoドデシル
 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ シアノアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、
 10 シアノ基によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状
 のアルキル基を表し、例えばシアノメチル基、1-シアノエチル基、2-シアノエチル基、
 3-シアノプロピル基、1-シアノ-1-メチルエチル基、4-シアノブチル基、2-シアノ-1, 1-
 ジメチルエチル基、1-シアノ-1-メチルプロピル基、1-シアノ-1-エチルプロピル基、6-
 シアノヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択さ
 15 れる。

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルキルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状
 の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出
 来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換され
 ていてもよい。例えばシクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロ
 20 プロピル基、2, 2-ジメチルシクロプロピル基、2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル基、
 シクロブチル基、1-メチルシクロブチル基、2, 3, 4-トリメチルシクロブチル基、シクロ
 ペンチル基、1-メチルシクロペンチル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロ
 ペンチル基、1-エチルシクロペンチル基、2-エチルシクロペンチル基、3-エチルシクロ
 ペンチル基、1-n-プロピルシクロペンチル基、1, 2-ジメチルシクロペンチル基、1, 3-ジ
 25 メチルシクロペンチル基、2, 2-ジメチルシクロペンチル基、2, 3-ジメチルシクロペンチ
 ル基、2, 4-ジメチルシクロペンチル基、2, 5-ジメチルシクロペンチル基、3, 4-ジメチル
 シクロペンチル基、2, 2, 4-トリメチルシクロペンチル基、2, 3, 4-トリメチルシクロペン
 チル基、2, 4, 4-トリメチルシクロペンチル基、シクロヘキシル基、1-メチルシクロヘキ
 シル基、2-メチルシクロヘキシル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

43

シル基、1-エチルシクロヘキシル基、2-エチルシクロヘキシル基、4-エチルシクロヘキシル基、2,3-ジメチルシクロヘキシル基、2,4-ジメチルシクロヘキシル基、2,5-ジメチルシクロヘキシル基、2,6-ジメチルシクロヘキシル基、3,3-ジメチルシクロヘキシル基、3,4-ジメチルシクロヘキシル基、3,5-ジメチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、シス-ピシクロ [3. 1. 0] ヘキサ-2-イル基、ピシクロ [2. 1. 1] ヘキサ-5-イル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。

また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっている場合、例えば1-ブロモシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジブロモシクロプロピル基、2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジブロモ-1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジクロロ-3,3-ジメチルシクロプロピル基、1-ブロモシクロブチル基、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル基、3,4-ジブロモシクロペンチル基、1-ブロモシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基、3-クロロシクロヘキシル基、4-クロロシクロヘキシル基、2,2,6,6-テトラクロロシクロヘキシル基、1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-ウンデカフルオロシクロヘキシル基、2-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、3-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、2-トリクロロメチルシクロヘキシル基、3,5-ジトリフルオロメチルシクロヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル基、1-プロペニル基、1-メチルエテニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、1-メチル-1-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、3-ブテニル基、1,3-ブタジエニル基、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

44

- 1-ペンテニル基、1-メチル-1-ブテニル基、3-メチル-1-ブテニル基、1, 2-ジメチル-1-プロペニル基、2-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、1-エチル-2-プロペニル基、1, 1-ジメチル-2-プロペニル基、1, 2-ジメチル-2-プロペニル基、3-ペンテニル基、1-メチル-3-ブテニル基、2-メチル-3-ブテニル基、3-メチル-3-ブテニル基、4-ペンテニル基、1, 3-ペンタジエニル基、1-ビニル-2-プロペニル基、1-ヘキセニル基、1-メチル-1-ペンテニル基、1-(i-ブチル)エテニル基、2-ヘキセニル基、2-メチル-2-ペンテニル基、1-エチル-2-ブテニル基、1, 3-ジメチル-2-ブテニル基、1-プロピル-2-プロペニル基、1-(i-プロピル)-2-プロペニル基、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル基、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル基、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル基、3-ヘキセニル基、3-メチル-3-ペンテニル基、4-メチル-3-ペンテニル基、1-エチル-3-ブテニル基、1, 1-ジメチル-3-ブテニル基、1, 2-ジメチル-3-ブテニル基、1, 3-ジメチル-3-ブテニル基、4-ヘキセニル基、1-メチル-4-ペンテニル基、3-メチル-4-ペンテニル基、4-メチル-4-ペンテニル基、5-ヘキセニル基、1, 5-ヘキサジエニル基、1-ビニル-3-ブテニル基、2, 4-ヘキサジエニル基、1-ヘプテニル基、3-メチル-1-ヘキセニル基、2-エチル-1-ペンテニル基、2-ヘプテニル基、1, 2-ジメチル-2-ペンテニル基、1-(i-プロピル)-2-ブテニル基、1-ブチル-2-プロペニル基、3-ヘプテニル基、1-(i-プロピル)-3-ブテニル基、1-エチル-1-メチル-3-ブテニル基、1-エチル-3-メチル-3-ブテニル基、1, 1, 2-トリメチル-3-ブテニル基、1, 1, 3-トリメチル-3-ブテニル基、2, 2, 3-トリメチル-3-ブテニル基、4-ヘプテニル基、1-エチル-4-ペンテニル基、1, 1-ジメチル-4-ペンテニル基、1, 3-ジメチル-4-ペンテニル基、1, 4-ジメチル-4-ペンテニル基、2, 2-ジメチル-4-ペンテニル基、5-ヘプテニル基、6-ヘプテニル基、2, 4-ヘプタジエニル基、3-メチル-1-ビニル-3-ブテニル基、1, 3, 5-ヘプタトリエニル基、1-オクテニル基、2-オクテニル基、1-メチル-2-ヘプテニル基、2-エチル-2-ヘキセニル基、1-エチル-2-メチル-2-ペンテニル基、1-ペンチル-2-プロペニル基、2-ネオペンチル-2-プロペニル基、3-オクテニル基、1-(i-プロピル)-3-メチル-3-ブテニル基、1-エチル-1, 2-ジメチル-3-ブテニル基、1-エチル-1, 3-ジメチル-3-ブテニル基、1, 5-ジメチル-4-ヘキセニル基、3, 3, 4-トリメチル-4-ペンテニル基、5-オクテニル基、3-メチル-5-ヘプテニル基、1, 5-ジメチル-5-ヘキセニル基、7-オクテニル基、2, 4-オクタジエニル基、2, 7-オクタジエニル基、1-(2-メチル-2-プロペニル)-2-ブテニル基、1-(i-プロペニル)-4-ペンテニル基、1-(i-プロペ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

45

ニル)-3-メチル-3-ブテニル基、1,1,4-トリメチル-2,4-ペンタジエニル基、5-メチル-2-メチレン-5-ヘキセニル基、1-ノネニル基、1-メチル-1-オクテニル基、2-ノネニル基、1-(n-ヘキシル)-2-プロペニル基、3-ノネニル基、3-(ネオペンチル)-3-ブテニル基、1,1,5-トリメチル-4-ヘキセニル基、7-メチル-5-オクテニル基、2,6-ジメチル-5-ヘプテニル基、4,4,5-トリメチル-5-ヘキセニル基、6-ノネニル基、8-ノネニル基、2,4-ノナジエニル基、2,6-ノナジエニル基、3,6-ノナジエニル基、2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル基、2,4-ジメチル-2,6-ヘプタジエニル基、1,4-ジメチル-1,3,5-ヘプタトリエニル基、1,3-ジメチル-1,4,6-ヘプタトリエニル基、1-デセニル基、1,2-ジメチル-1-オクテニル基、4-デセニル基、2-(i-プロピル)-5-メチル-4-ヘキセニル基、1-エチル-1,5-ジメチル-4-ヘキセニル基、1-エチル-3,3,4-トリメチル-4-ペンテニル基、5-デセニル基、5-エチル-1,1-ジメチル-5-ヘキセニル基、3,7-ジメチル-6-オクテニル基、1,1,5-トリメチル-6-ヘプテニル基、7-デセニル基、3,7-ジメチル-7-オクテニル基、9-デセニル基、2-アリル-5-メチル-4-ヘキセニル基、1,1,4-トリメチル-2-ビニル-3-ペンテニル基、1-メチレン-3-ノネニル基、2,4-デカジエニル基、1-メチル-1,3-ノナジエニル基、5,9-デカジエニル基、1,5-ジメチル-1-ビニル-4-ヘキセニル基、3,7-ジメチル-2,6-オクタジエニル基、1-エチル-1,5-ジメチル-2,4-ヘキサジエニル基、1-(1-メチルエテニル)-4-メチル-3,5-ヘキサジエニル基、1-ウンデセニル基、2-ウンデセニル基、4-ウンデセニル基、1,3,7-トリメチル-6-オクテニル基、10-ウンデセニル基、2,4-ウンデカジエニル基、5,10-ウンデカジエニル基、2,5,8-ウンデカトリエニル基、1-ドデセニル基、2-ドデセニル基、5-ドデセニル基、1-エチル-3,7-ジメチル-6-オクテニル基、7-ドデセニル基、1-エチル-3,7-ジメチル-7-オクテニル基、8-ドデセニル基、9-ドデセニル基、10-ドデセニル基、11-ドデセニル基、2,4-ドデカジエニル基、5,7-ドデカジエニル基、8,10-ドデカジエニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっている場合、例えば 2-クロロビニル基、2-ブロモビニル基、2-ヨードビニル基、2,2-ジクロロビニル基、2,2-ジブロモビニル基、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

46

- 3-プロモ-2-プロペニル基、1-クロロメチルビニル基、2-プロモ-1-メチルビニル基、1-トリフルオロメチルビニル基、3,3,3-トリクロロ-1-プロペニル基、3-プロモ-3,3-ジフルオロ-1-プロペニル基、2-クロロ-3,3,3-トリフルオロ-1-プロペニル基、2,3,3,3-テトラクロロ-1-プロペニル基、1-トリフルオロメチル-2,2-ジフルオロビニル基、2-クロロ-2-プロペニル基、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル基、3,3-ジクロロ-2-プロペニル基、2,3,3-トリフルオロ-2-プロペニル基、2,3,3-トリクロロ-2-プロペニル基、4-プロモ-3-クロロ-3,4,4-トリフルオロ-1-ブテニル基、1-プロモメチル-2-プロペニル基、3-クロロ-2-ブテニル基、4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル基、4-プロモ-4,4-ジフルオロ-2-ブテニル基、3-プロモ-3-ブテニル基、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル基、3,4,4-トリフルオロ-3-ブテニル基、3,4,4-トリプロモ-3-ブテニル基、3-プロモ-2-メチル-2-プロペニル基、3,3,3-トリフルオロ-2-メチルプロペニル基、3-クロロ-4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル基、3,3,3-トリフルオロ-1-メチル-1-プロペニル基、3,3,3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチル-1-プロペニル基、1,3,3,3-テトラフルオロ-2-トリフルオロメチル-1-プロペニル基、3,4,4-トリフルオロ-1,3-ブタジエニル基、3,4-ジプロモ-1-ペンテニル基、3,3,4,4,5,5,5-ヘプタフルオロ-1-ペンテニル基、5,5-ジフルオロ-4-ペンテニル基、4,5,5-トリフルオロ-4-ペンテニル基、3,4,4,4-テトラフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ブテニル基、3,5,5-トリフルオロ-2,4-ペンタジエニル基、4,4,5,5,6,6,6-ヘプタフルオロ-2-ヘキセニル基、3,4,4,5,5,5-ヘキサフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ペンテニル基、4,5,5,5-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル基、5-プロモ-4,5,5-トリフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル基、3,3,3-トリフルオロ-1-ペンタフルオロエチル-2-トリフルオロメチル-1-プロペニル基、4,5,5,6,6,6-ヘキサフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ヘキセニル基、3-パーフルオロブチル-2-プロペニル基、3-ヨード-2-オクテニル基、2-パーフルオロヘキシルエテニル基、3-パーフルオロヘキシル-2-プロペニル基、12-プロモ-2-ドデセニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、1-

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

47

エチル-2-プロピニル基、1, 1-ジメチル-2-プロピニル基、3-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-3-ブチニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1, 1-ジメチル-2-プロピニル基、1-ヘキシニル基、3, 3-ジメチル-1-ブチニル基、1-(n-プロピル)-2-プロピニル基、2-ヘキシニル基、1-エチル-2-ブチニル基、3-ヘキシニル基、1-メチル-2-ペンチニル基、1-メチル-3-ペンチニル基、5-ヘキシニル基、1-エチル-3-ブチニル基、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル基、1-(i-プロピル)-2-プロピニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基、2, 2-ジメチル-3-ブチニル基、1-ヘプチニル基、1-(n-ブチル)-2-プロピニル基、2-ヘプチニル基、3-ヘプチニル基、1-メチル-3-ヘキシニル基、1-エチル-2-ペンチニル基、1-エチル-3-ペンチニル基、6-ヘプチニル基、1-メチル-1-(n-プロピル)-2-プロピニル基、1-(i-プロピル)-1-メチル-2-プロピニル基、1-(i-ブチル)-2-プロピニル基、5-メチル-3-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ペンチニル基、1-エチル-1-メチル-2-ブチニル基、1-オクチニル基、1-(n-ペンチル)-2-プロピニル基、2-オクチニル基、3-オクチニル基、1-メチル-3-ヘプチニル基、1-エチル-3-ヘキシニル基、7-オクチニル基、1-(n-ブチル)-1-メチル-2-プロピニル基、1-(1-メチルブチル)-2-プロピニル基、1-(i-ブチル)-1-メチル-2-プロピニル基、2-ノニル基、3-ノニル基、1-エチル-3-ヘプチニル基、1-メチル-1-(n-ペンチル)-2-プロピニル基、1-(n-ブチル)-1-メチル-2-ブチニル基、1-(n-ブチル)-1-エチル-2-プロピニル基、1-(1-エチルプロピル)-1-メチル-2-プロピニル基、1-デシニル基、2-デシニル基、3-デシニル基、5-デシニル基、9-デシニル基、1-(n-ヘキシル)-1-メチル-2-プロピニル基、2-ウンデシニル基、10-ウンデシニル基、5, 10-ウンデカジニル基、3-ドデシニル基、7-ドデシニル基、9-ドデシニル基、10-ドデシニル基、11-ドデシニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。

このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっても良い。例えば 2-クロロエチニル基、2-ブロモエチニル基、2-ヨードエチニル基、3-クロロ-2-プロピニル基、3-ブロモ-2-プロピニル基、3-ヨード-2-プロピニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロピニル基、3-クロ

ロ-1-メチル-2-プロピニル基、3-ブromo-1-メチル-2-プロピニル基、3-ヨード-1-メチル-2-プロピニル基、3-クロロ-1,1-ジメチル-2-プロピニル基、3-ブromo-1,1-ジメチル-2-プロピニル基、3-ヨード-1,1-ジメチル-2-プロピニル基、1-クロロメチル-1-メチル-2-ブチニル基、4-クロロ-2,2-ジメチル-3-ブチニル基、4-ブromo-2,2-ジメチル-3-ブチニル基、4-ヨード-2,2-ジメチル-3-ブチニル基、10-ブromo-9-デシニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルケニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合は *endo*-又は *exo*-のどちらの形式であってもよい。例えばシクロペンテン-1-イル基、2-シクロペンテン-1-イル基、3-シクロペンテン-1-イル基、3-メチレンシクロペンチル基、シクロヘキセン-1-イル基、2-シクロヘキセン-1-イル基、3-シクロヘキセン-1-イル基、4-メチレンシクロヘキシル基、3-メチル-2-シクロヘキセン-1-イル基、2-メチル-2-シクロヘキセン-1-イル基、1-メチル-2-シクロヘキセン-1-イル基、4-メチル-3-シクロヘキセン-1-イル基、1-メチル-3-シクロヘキセン-1-イル基、6-メチル-3-シクロヘキセン-1-イル基、6-メチル-2-メチレンシクロヘキシル基、2-エチル-3-シクロヘキセン-1-イル基、4,6-ジメチル-3-シクロヘキセン-1-イル基、2-メチル-2,5-シクロヘキサジエン-1-イル基、ビスクロ [2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル基、2-メチルビスクロ [2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合は *endo*-又は *exo*-のどちらの形式であってもよい。また、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。例えば2-クロロビスクロ [2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

49

基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-0-基を表し、例えばメトキシ基、エトキシ基、*n*-プロピルオキシ基、*i*-プロピルオキシ基、*n*-ブチルオキシ基、*s*-ブチルオキシ基、*i*-ブチルオキシ基、*t*-ブチルオキシ基、*n*-ペンチルオキシ基、1-メチルブチルオキシ基、2-メチルブチルオキシ基、3-メチルブチルオキシ基、1-エチルプロピルオキシ基、1, 1-ジメチルプロピルオキシ基、1, 2-ジメチルプロピルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、1, 1-ジメチルブチルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-0-基を表し、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、2-ブromo-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2-ブromo-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、2, 2-ジクロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリクロロ-1, 1-ジフルオロエトキシ基、2-クロロプロピルオキシ基、3-クロロプロピルオキシ基、ヘプタフルオロプロピルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエトキシ基、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロピルオキシ基、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基、2-ブromo-1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

25 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルキルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロシクロアルキル-0-基を表し、例えば 2, 2, 4, 4-テトラフルオロシクロブチルオキシ基、2-クロロ-2, 3, 3-トリフルオロシクロブチルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル-0-基を表し、例えばアリルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、1-メチル-2-プロペニルオキシ基、3-メチル-2-ブテニルオキシ基、1, 1-ジメチル-2-プロペニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択され

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

50

る。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルケニル-0-基を表し、例えば 3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ基、2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルオキシ基、3, 3, 3-トリフルオロ-1-(ペンタフルオロエチル)-2-(トリフルオロメチル)-1-プロペニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル-0-基を表し、例えばプロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、1-エチル-2-プロピニルオキシ基、2-ペンチニルオキシ基、1-メチル-2-ブチニルオキシ基、1, 1-ジメチル-2-プロピニルオキシ基、2-ヘキシニルオキシ基、1-エチル-2-ブチニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキニル-0-基を表し、例えば 3-クロロ-2-プロピニルオキシ基、3-ブロモ-2-プロピニルオキシ基、3-ヨード-2-プロピニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S-基を表し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、i-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、s-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、1-メチルブチルチオ基、2-メチルブチルチオ基、3-メチルブチルチオ基、1-エチルプロピルチオ基、1, 1-ジメチルプロピルチオ基、1, 2-ジメチルプロピルチオ基、ネオペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S-基を表し、例えばジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、プロモジフルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ基、1, 1, 2-トリフルオロ-2-クロロエチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基、2-ブロモ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ基、ヘプタフ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

51

ルオロプロピルチオ基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチルチオ基、ノナフルオロブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

5 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル-S-基を表し、例えばアリルチオ基、2-ブテニルチオ基、1-メチル-2-プロペニルチオ基、3-メチル-2-ブテニルチオ基、1, 1-ジメチル-2-プロペニルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルケニル-S-基を表し、例えば 3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルチオ基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルチオ基、2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルチオ基、3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテニルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

15 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル-S-基を表し、例えばプロパルギルチオ基、2-ブチニルチオ基、2-ペンチニルチオ基、1-メチル-2-ブチニルチオ基、1, 1-ジメチル-2-プロピニルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S (0)-基を表し、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、n-プロピルスルフィニル基、i-プロピルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、s-ブチルスルフィニル基、i-ブチルスルフィニル基、t-ブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

25 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S (0)-基を表し、例えばジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、ブロモジフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル基、2-ブロモ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチルスルフィニル基、ノナフルオロブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

52

よりなる前記の意味であるハロアルケニル-S(0)-基を表し、例えば 3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテニルスルフェニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

5 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-SO₂-基を表し、例えばメタンスルホニル基、エタンスルホニル基、*n*-プロピルスルホニル基、*i*-プロピルスルホニル基、*n*-ブチルスルホニル基、*s*-ブチルスルホニル基、*i*-ブチルスルホニル基、*t*-ブチルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-SO₂-基を表し、例えばジフルオロメタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、クロロジフルオロメタンスルホニル基、プロモジフルオロメタンスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエタンスルホニル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエタンスルホニル基、1, 1, 2-トリフルオロ-2-クロロエタンスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

15 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルケニル-SO₂-基を表し、例えば 3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルスルホニル基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルスルホニル基、2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルスルホニル基、3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテニルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、*n*-プロピルアミノ基、*i*-プロピルアミノ基、*n*-ブチルアミノ基、*i*-ブチルアミノ基、*t*-ブチルアミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

25 本明細書におけるジ($C_a \sim C_b$ アルキル)アミノの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも、又は互いに相異なっているもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばジメチルアミノ基、エチル(メチル)アミノ基、ジエチルアミノ基、*n*-プロピル(メチル)アミノ基、*i*-プロピル(メチル)アミノ基、ジ(*n*-プロピル)アミノ基、*n*-ブチル(メチル)アミノ基、*i*-ブチル(メチル)

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

53

アミノ基、*t*-ブチル(メチル)アミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-C(=O)-基を表し、例えば $CH_3C(=O)-$ 基、 $CH_3CH_2C(=O)-$ 基、

- 5 $CH_3CH_2CH_2C(=O)-$ 基、 $(CH_3)_2CHC(=O)-$ 基、 $CH_3(CH_2)_3C(=O)-$ 基、 $(CH_3)_2CHCH_2C(=O)-$ 基、 $CH_3CH_2CH(CH_3)C(=O)-$ 基、 $(CH_3)_3CC(=O)-$ 基、 $CH_3(CH_2)_4C(=O)-$ 基、 $CH_3(CH_2)_5C(=O)-$ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-C(=O)-基を表し、例えば $FCH_2C(=O)-$ 基、 $ClCH_2C(=O)-$ 基、

10 $F_2CHC(=O)-$ 基、 $Cl_2CHC(=O)-$ 基、 $CF_3C(=O)-$ 基、 $ClCF_2C(=O)-$ 基、 $BrCF_2C(=O)-$ 基、 $CCl_3C(=O)-$ 基、 $CF_3CF_2C(=O)-$ 基、 $ClCH_2CH_2CH_2C(=O)-$ 基、 $CF_3CF_2CF_2C(=O)-$ 基、 $ClCH_2C(CH_3)_2C(=O)-$ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-O-C(=O)-基を表し、例えば $CH_3OC(=O)-$ 基、 $CH_3CH_2OC(=O)-$ 基、

15 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)-$ 基、 $(CH_3)_2CHOC(=O)-$ 基、 $CH_3(CH_2)_3OC(=O)-$ 基、 $(CH_3)_2CHCH_2OC(=O)-$ 基、 $(CH_3)_3COC(=O)-$ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-O-C(=O)-基を表し、例えば $ClCH_2CH_2OC(=O)-$ 基、

- 20 $CF_3CH_2OC(=O)-$ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば $CH_3NHC(=O)-$ 基、 $CH_3CH_2NHC(=O)-$ 基、 $CH_3CH_2CH_2NHC(=O)-$ 基、 $(CH_3)_2CHNHC(=O)-$ 基、 $CH_3(CH_2)_3NHC(=O)-$ 基、 $(CH_3)_2CHCH_2NHC(=O)-$ 基、 $CH_3CH_2CH(CH_3)NHC(=O)-$ 基、 $(CH_3)_3CNHC(=O)-$ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

25

本明細書におけるジ($C_a \sim C_b$ アルキル)アミノカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも、又は互いに相異なっているもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば $(CH_3)_2NC(=O)-$ 基、 $CH_3CH_2N(CH_3)C(=O)-$ 基、 $(CH_3CH_2)_2NC(=O)-$ 基、 $(CH_3CH_2CH_2)_2NC(=O)-$ 基等が具体例として挙

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

54

げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノチオカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたチオカルバモイル基を表し、例えば $CH_3NHC(S)$ -基、 $CH_3CH_2NHC(S)$ -基、 $CH_3CH_2CH_2NHC(S)$ -基、

- 5 $(CH_3)_2CHNHC(S)$ -基、 $CH_3(CH_2)_3NHC(S)$ -基、 $(CH_3)_2CHCH_2NHC(S)$ -基、 $CH_3CH_2CH(CH_3)NHC(S)$ -基、 $(CH_3)_3CNHC(S)$ -基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- 10 本明細書におけるジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノチオカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも、又は互いに相異なっているもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたチオカルバモイル基を表し、例えば $(CH_3)_2NC(S)$ -基、 $CH_3CH_2N(CH_3)C(S)$ -基、 $(CH_3CH_2)_2NC(S)$ -基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- 15 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル- SO_2 -0-基を表し、例えば CH_3SO_2 -0-基、 $CH_3CH_2SO_2$ -0-基、 $CH_3CH_2CH_2SO_2$ -0-基、 $(CH_3)_2CHSO_2$ -0-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル- SO_2 -0-基を表し、例えば CF_3SO_2 -0-基、 $CF_3CF_2SO_2$ -0-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- 20 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-C(=O)-0-基を表し、例えば $CH_3C(=O)$ -0-基、 $CH_3CH_2C(=O)$ -0-基、 $CH_3CH_2CH_2C(=O)$ -0-基、 $(CH_3)_2CHC(=O)$ -0-基、 $CH_3(CH_2)_3C(=O)$ -0-基、 $(CH_3)_2CHCH_2C(=O)$ -0-基、 $CH_3CH_2CH(CH_3)C(=O)$ -0-基、 $(CH_3)_3CC(=O)$ -0-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- 25 本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルカルボニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-C(=O)-0-基を表し、例えば $FCH_2C(=O)$ -0-基、 $ClCH_2C(=O)$ -0-基、 $F_2CHC(=O)$ -0-基、 $Cl_2CHC(=O)$ -0-基、 $CF_3C(=O)$ -0-基、 $ClCF_2C(=O)$ -0-基、 $BrCF_2C(=O)$ -0-基、 $CCl_3C(=O)$ -0-基、 $CF_3CF_2C(=O)$ -0-基、 $CF_3CF_2CF_2C(=O)$ -0-基、 $ClCH_2CH_2CH_2C(=O)$ -0-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

55

される。

本明細書における R^7 によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキル又は R^{31} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルキルの表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} によって、
 5 炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、ここで、それぞれの ($C_a \sim C_b$) アルキル基上の置換基 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} が2個以上存在するとき、それぞれの R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} は互いに同一でも、または互いに相異なっているもよい。

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルキル ($C_d \sim C_e$) アルキル、ヒドロキシ ($C_d \sim C_e$) アルキル、
 10 $C_a \sim C_b$ アルコキシ ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオ ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、ジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノカルボニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、トリメチルシリル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $L-(C_d \sim C_e)$ アルキル又は $M-(C_d \sim C_e)$ アルキル等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ シクロアルキル基、水酸基、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオ基、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル基、 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニル基、 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル基、 $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニル基、ジ ($C_a \sim C_b$ アルキル) アミノカルボニル基、トリメチルシリル基、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル基、 L 基又は M 基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書におけるヒドロキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアル

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

56

- キル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルケニルオキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルオキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキニルオキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルオキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルキル又は (Z) p_1 に
 よって置換されていてもよいベンジルオキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルキル等の表記は、それぞれ
- 5 前記の意味である任意の水酸基、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ アルケニルオキシ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルオキシ基、 $C_a \sim C_b$ アルキニルオキシ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルオキシ基又は (Z) p_1 によって置換されていてもよいベンジルオキシ基によって、炭素原子に結合した水素原子又はハロゲン原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル基を表し、例えば 1, 2, 2, 2-テトラフル
- 10 オロ-1-(メトキシ)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-(メチル)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-エトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-n-プロピルオキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-i-プロピルオキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-n-ブチルオキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-アリルオキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-(3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ)-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-(3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ)-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチル-1-(2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルオキシ)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-プロパルギルオキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-ベンジルオキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2-クロロ-1-ヒドロキシ-2, 2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2-クロロ-2, 2-ジフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2-ブ
- 20 モ-1-ヒドロキシ-2, 2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2-ブromo-2, 2-ジフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-ヒドロキシ-2-メチル-1-(トリフルオロメチル)プロピル基、1-ヒドロキシ-2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル基、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)プロピル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。
- 25

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

57

- 本明細書における R^7 によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル又は R^{31} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル等の表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表す。このとき、 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} による置換は、環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、それぞれの ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル基上の置換基 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} が 2 個以上存在するとき、それぞれの R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} は互いに同一でも、または互いに相異なっているもよい。
- 10 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニル ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルケニル ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル、ヒドロキシ ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル又は $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルケニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルケニル基、
- 15 水酸基、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル基又は $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表し、例えば 2-ビニルシクロプロピル基、3, 3-ジメチル-2-(2-メチル-1-プロペニル) シクロプロピル基、2-(2, 2-ジクロロエテニル)-3, 3-ジメチルシクロプロピル基、2-(2-クロロ-3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロペニル)-3, 3-ジメチルシクロプロピル基、1-(メチルチオメチル) シクロプロピル基、1-(メチルスルフィニルメチル) シクロプロピル基、1-(メチルスルホニルメチル) シクロプロピル基、1-(メチルチオメチル) シクロブチル基、2-アリルシクロペンチル基、1-(ヒドロキシメチル) シクロペンチル基、1-(メチルチオメチル) シクロペンチル基、1-(メチルスルフィニルメチル) シクロペンチル基、1-(メチルスルホニルメチル) シクロペンチル基、2-(メチルチオ) シクロペンチル基、2-(メチルチオ) シクロヘキシル基等が
- 25 具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における R^7 によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルケニル又は R^{31} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルケニルの表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} に

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

58

よって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル基を表し、ここで、それぞれの $(C_a \sim C_b)$ アルケニル基上の置換基 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} が 2 個以上存在するとき、それぞれの R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} は互いに同一でも、または互いに相異なっているもよい。

- 5 本明細書における $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_a \sim C_b)$ アルケニル又は $L-(C_a \sim C_b)$ アルケニル等の表記は、任意の $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル基又は L 基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル基を表し、例えば 1, 1-ジメチル-3-フェニル-2-プロペニル基、1, 1-ジメチル-3-(チオフェン-2-イル)-2-プロペニル基等が具体例として
- 10 挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- 本明細書における R^7 によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニル又は R^{31} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニルの表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる
- 15 前記の意味であるアルキニル基を表し、ここでそれぞれの $(C_a \sim C_b)$ アルキニル基上の置換基 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} が 2 個以上存在するとき、それぞれの R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} は互いに同一でも、または互いに相異なっているもよい。

- 本明細書における $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_a \sim C_b)$ アルキニル又は $L-(C_a \sim C_b)$ アルキニル等の表記は、任意の $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル基
- 20 又は L 基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル基を表し、例えば 1, 1-ジメチル-3-フェニル-2-プロピニル基、1, 1-ジメチル-3-(チオフェン-2-イル)-2-プロピニル基、1, 1-ジメチル-3-(チオフェン-3-イル)-2-プロピニル基、1, 1-ジメチル-3-(ピリジン-2-イル)-2-プロピニル基、1, 1-ジメチル-3-(ピリジン-3-イル)-2-プロピニル基等が具体例として挙げられ、
- 25 各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル $(C_d \sim C_e)$ アルコキシ、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル $(C_d \sim C_e)$ アルコキシ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_a \sim C_b)$ アルコキシ等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル基又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよい

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

59

フェニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるアルコキシ基を表し、例えば $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{-O-基}$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{-O-基}$ 、 $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-基}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-基}$ 、 $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-O-基}$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-O-基}$ 、 $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-O-基}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-O-基}$ 、
 5 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{-O-基}$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-O-基}$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-O-基}$ 、
 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-O-基}$ 、 $\text{PhCH}_2\text{-O-基}$ 、 $\text{PhCH}_2\text{CH}_2\text{-O-基}$ 、 $\text{PhCH}(\text{CH}_3)\text{-O-基}$ 、 $\text{PhC}(\text{CH}_3)_2\text{-O-基}$
 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ アルコキシ ($\text{C}_d \sim \text{C}_e$) ハロアルコキシ、 $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ ハロアルコキシ ($\text{C}_d \sim \text{C}_e$) ハロアルコキシ又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($\text{C}_d \sim \text{C}_e$) ハロアル
 10 コキシ等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ アルコキシ基、 $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ ハロアル
 コキシ基又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル基によって、炭素原子に結
 合した水素原子又はハロゲン原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記
 の意味であるハロアルコキシ基を表し、例えば 1, 1, 2-トリフルオロ-2-(トリフルオロメ
 トキシ)エトキシ基、1, 1, 2-トリフルオロ-2-(エトキシ)エトキシ基、1, 1, 2-トリフルオ
 15 ロ-2-(2-プロモ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)エトキシ基、1, 1, 2-トリフルオロ-2-
 (ヘプタフルオロプロピルオキシ)エトキシ基、ヘキサフルオロ-2-(ヘプタフルオロプロ
 ピルオキシ)プロピルオキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロ-2-フェニルエトキシ基等が具
 体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ アルコキシ ($\text{C}_d \sim \text{C}_e$) ハロアルケニルオキシ又は $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ ハロアル
 20 コキシ ($\text{C}_d \sim \text{C}_e$) ハロアルケニルオキシ等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $\text{C}_a \sim \text{C}_b$
 C_b アルコキシ基又は $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ ハロアルコキシ基によって、炭素原子に結合した水素原子又は
 ハロゲン原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるハロア
 ルケニルオキシ基を表し、例えば 3, 3, 3-トリフルオロ-1-メトキシ-2-(トリフルオロメチ
 ル)-1-プロペニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲
 25 で選択される。

本明細書における $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ アルコキシ ($\text{C}_d \sim \text{C}_e$) アルコキシ ($\text{C}_f \sim \text{C}_g$) アルキル等の表記は、
 前記の意味である任意の $\text{C}_a \sim \text{C}_b$ アルコキシ ($\text{C}_d \sim \text{C}_e$) アルコキシ基によって、炭素原子に結
 合した水素原子が任意に置換された、炭素原子数が $f \sim g$ 個よりなる前記の意味であるア
 ルキル基を表し、例えば 2-(2-メトキシエトキシ)エチル基、2-(2-エトキシエトキシ)エ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

60

チル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

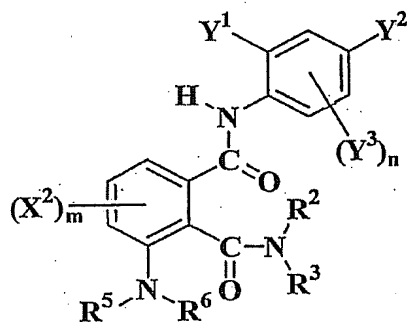
本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルコキシ ($C_f \sim C_g$) ハロアルコキシ等の表記は、前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ ($C_d \sim C_e$) ハロアルコキシ基によって、炭素原子に結合した水素原子又はハロゲン原子が任意に置換された炭素原子

5 数が $f \sim g$ 個よりなる前記の意味であるハロアルコキシ基を表し、例えば 1, 1, 2-トリフルオロ-2-(ヘキサフルオロ-2-(ヘプタフルオロプロピルオキシ)プロピルオキシ)エトキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

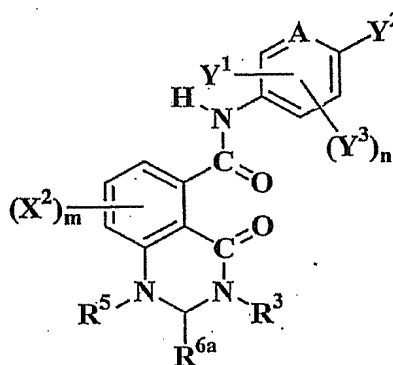
本明細書における $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_a \sim C_b$) アルキルカルボニルの表記は、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された前記の意味である ($C_a \sim C_b$) アルキルカルボニル基を表し、例えば $PhCH_2-C(O)-$ 基、 $PhCH_2CH_2-C(O)-$ 基、 $PhCH(CH_3)-C(O)-$ 基、 $PhC(CH_3)_2-C(O)-$ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_a \sim C_b$) アルコキシカルボニルの表記は、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された前記の意味である ($C_a \sim C_b$) アルコキシカルボニル基を表し、例えば $PhCH_2-O-C(O)-$ 基、 $PhCH_2CH_2-O-C(O)-$ 基、 $PhCH(CH_3)-O-C(O)-$ 基、 $PhC(CH_3)_2-O-C(O)-$ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

一般式 (1) で表される本発明化合物のうち、好ましい化合物は下記の一般式 (4)
20 又は一般式 (5) で表される化合物である。



(4)



(5)

Y^2 で表される置換基に関して、好ましい範囲は下記の各群である。

すなわち、 Y^2-I : 水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

61.

アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル。

5 Y^2-II : $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル。

Y^2-III : ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル又は (Z)_{p1} によって置換されて

10 いてもよいベンジルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル。

Y^2-IV : $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-58 又は M。

Y^2-V : $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェノキシ、-O- (L-17)、-O- (L-45)、-O- (L-48) 又は

20 は-O- (L-49)。

Y^2-VI : $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルチオ、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルチオ、-S- (L-17)、-S- (L-45)、-S- (L-48)、-S- (L-49)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、-N (R⁹) R¹⁰ 又は

25 -Si (CH₃)₂ R¹⁴。

Y^2-VII : Y^2 が隣接する Y^3 と $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 又は $-N (R^{17}) CH=N-$ を形成することにより、 Y^2 及び Y^3 が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成し、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R¹⁸ によって任意に置

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

62

換されていてもよい。

R^3 で表される置換基に関して、好ましい範囲は下記の各群である。

- すなわち、 $R^3-I: C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $L-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_8$) アルキニル又は $L-(C_1 \sim C_8)$ アルキニル。
- $R^3-II: HO-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $R^{8c}-O-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-1)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-2)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-3)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-4)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-5)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-6)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-7)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-14)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-15)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-16)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-23)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-24)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-25)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $M-5$ 、 $M-15$ 、 $M-16$ 又は $M-25$ 。
- $R^3-III: HS-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $R^{29}-S-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $R^{29}-S(O)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $R^{29}-S(O)_2-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-8)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-9)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-10)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-11)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-17)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-18)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-19)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-26)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-27)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-28)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $M-9$ 、 $M-18$ 、 $M-19$ 又は $M-28$ 。
- $R^3-IV: R^{8c}N(R^9)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-12)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-13)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-20)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-21)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(M-22)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $M-13$ 、 $M-21$ 又は $M-22$ 。
- $R^3-V: HC(O)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルカルボニル ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $(C_1 \sim C_8)$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $R^{10}N(R^{11})C(O)-(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $R^{12}ON=CH-(C_1 \sim C_8)$ アルキル又は $R^{12}ON=C(R^{10})-(C_1 \sim C_8)$ アルキル。
- $R^3-VI: C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル。
- $R^3-VII: C_1 \sim C_8$ アルコキシ又はジ ($C_1 \sim C_8$ アルキル) アミノ。
- $R^3-VIII: R^3$ が R^2 と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

63

及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メチル基又はメトキシ基によって置換されていてもよい。

R^5 で表される置換基に関して、好ましい範囲は下記の各群である。

- すなわち、 R^5 -I : $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$)
 5 アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル。

- R^5 -II : $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、
 (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、
 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$)
 10 アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 L - ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は M - ($C_1 \sim C_4$) アルキル。

- R^5 -III : $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{20})R^{25}$ 又は
 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 。
 15 R^5 -IV : $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、
 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 又は $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 。

- R^5 -V : R^5 が R^6 と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～7員環を形成し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメ
 20 チル基によって任意に置換されていてもよい。

これらの一般式(1)で表される化合物に関して、好ましい化合物の範囲を示す一般式(4)及び一般式(5)と各置換基の好ましい範囲を示す各群とは、それぞれ任意に組み合わせることができ、それぞれ好ましい本発明化合物の範囲を表すが、以下に特に好ましい範囲の組み合わせを挙げる。

- 25 すなわち、一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -I、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -I、 R^3 -I と R^5 -IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

64

物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-I と R^5-II である本発明化合物。

5 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-I と R^5-III である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-I と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-I と R^5-V である本発明化合物。

10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-II と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-II と R^5-II である本発明化合物。

15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-II と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-III と R^5-II である本発明化合物。

20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-III と R^5-III である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-III と R^5-IV である本発明化合物。

25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-IV と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-IV と R^5-II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-IV と R^5-IV である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

65

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-V と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-V と R^5-II である本発明化合物。

5 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-V と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VI と R^5-I である本発明化合物。

10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VI と R^5-II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VI と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VII と R^5-I である本発明化合物。

15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VII と R^5-II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VII と R^5-IV である本発明化合物。

20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VIII と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VIII と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-I と R^5-I である本発明化合物。

25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-I と R^5-II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-I と R^5-III である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-I と R^5-IV である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

66

合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -I と R^5 -V である本発明化合物。

5 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -II と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -II と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -II と R^5 -IV である本発明化合物。

10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -III と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。

15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -III と R^5 -IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -IV と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -IV と R^5 -II である本発明化合物。

20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -IV と R^5 -IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -V と R^5 -I である本発明化合物。

25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -V と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -V と R^5 -IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VI と R^5 -I である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

67

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VIと R^5 -IIである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VIと R^5 -IVである本発明化合物。

5 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VIIと R^5 -Iである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VIIと R^5 -IVである本発明化合物。

10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VIIIと R^5 -Iである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VIIIと R^5 -IVである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -Iと R^5 -Iである本発明化合物。

15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -Iと R^5 -IIである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -Iと R^5 -IVである本発明化合物。

20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IIと R^5 -Iである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IIと R^5 -IVである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IIIと R^5 -Iである本発明化合物。

25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IIIと R^5 -IIである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IIIと R^5 -IVである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IVと R^5 -Iである本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

68

合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IVと R^5 -IVである本発明化合物。

5 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -Vと R^5 -Iである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -Vと R^5 -IVである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIと R^5 -Iである本発明化合物。

10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIと R^5 -IVである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIIと R^5 -Iである本発明化合物。

15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIIと R^5 -IVである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIIIと R^5 -Iである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIIIと R^5 -IVである本発明化合物。

20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -Iと R^5 -Iである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -Iと R^5 -IIである本発明化合物。

25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -Iと R^5 -IIIである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -Iと R^5 -IVである本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -Iと R^5 -Vである本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

69

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-II と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-II と R^5-II である本発明化合物。

5 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-II と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。

10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-III である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-IV である本発明化合物。

15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-IV と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-IV と R^5-II である本発明化合物。

20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-IV と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-V と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-V と R^5-II である本発明化合物。

25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-V と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-II である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

70

合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-IV である本発明化合物。

5 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VII と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VII と R^5-II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VII と R^5-IV である本発明化合物。

10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VIII と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VIII と R^5-IV である本発明化合物。

15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-I と R^5-I である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-I と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。

20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-III と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VII 、 R^3-I と R^5-I である本発明化合物。

25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VII 、 R^3-I と R^5-II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VII 、 R^3-I と R^5-IV である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VII 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

71

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -III と R^5 -IV である本発明化合物。

5 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -I、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。

10 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -III である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -IV である本発明化合物。

15 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -II と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -II と R^5 -II である本発明化合物。

20 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -III と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -IV と R^5 -I である本発明化合物。

25 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -IV と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -V と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -V と R^5 -II である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

72

化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VI と R^5-I である本発明化合物。

5 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-VI と R^5-II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-I と R^5-I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-I と R^5-II である本発明化合物。

10 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-II と R^5-I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-II と R^5-II である本発明化合物。

15 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-III と R^5-II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-IV と R^5-I である本発明化合物。

20 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-IV と R^5-II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-V と R^5-I である本発明化合物。

25 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-V と R^5-II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-VI と R^5-I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-III 、 R^3-VI と R^5-II である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

73

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -I と R^5 -II である本発明化合物。

5 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -II と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -II と R^5 -II である本発明化合物。

10 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -III と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IV と R^5 -I である本発明化合物。

15 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IV と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -V と R^5 -I である本発明化合物。

20 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -V と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VI と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VI と R^5 -II である本発明化合物。

25 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -I と R^5 -II である本発明化合物。

一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -V、 R^3 -I と R^5 -III である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

74

合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-II と R^5-I である本発明化合物。

5 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-II と R^5-II である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-II である本発明化合物。

10 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-IV と R^5-I である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-IV と R^5-II である本発明化合物。

15 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-V と R^5-I である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-V と R^5-II である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-I である本発明化合物。

20 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-II である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-I と R^5-I である本発明化合物。

25 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-I と R^5-II である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-III と R^5-II である本発明化合物。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

75

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。

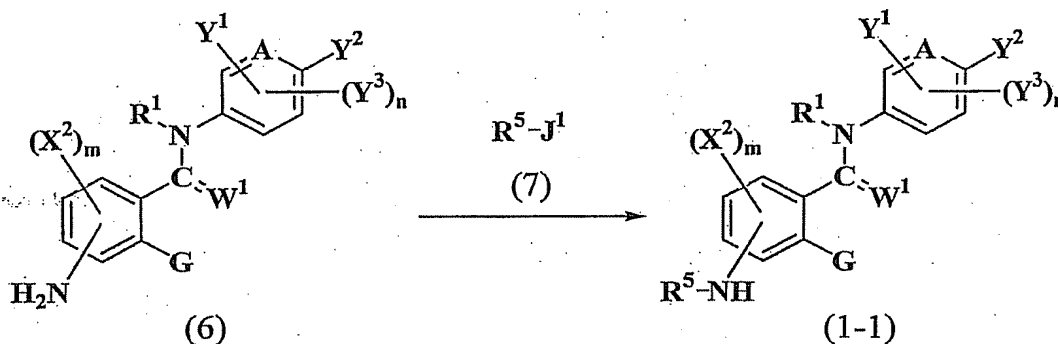
一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -I と R^5 -II である本発明化合物。

5 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -III と R^5 -I である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。

本発明化合物は、例えば以下の方法により製造することが出来る。

10 製造法 A



一般式 (6) [式中、A、G、 W^1 、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (7) [式中、 R^5 は前記と同じ意味を表し、 J^1 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基 (例えば、ピバロイルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート基 (例えば、メタンスルホニルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネート基 (例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基)、アリールスルホネート基 (例えば、ベンゼンスルホニルオキシ基、 p -トルエンスルホニルオキシ基) 又はアゾリル基 (例えば、イミダゾール-1-イル基) のような良好な脱離基を表す。] で表される化合物とを、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式 (1) において X^1 が $-NHR^5$ である

15 一般式 (1-1) [式中、A、G、 W^1 、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 、 R^5 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式 (6) で表される化合物 1 当量に対して 1 ~ 50 当量の一般式 (7) で表される化合物を用いることができる。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

76

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、
5 四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチル
10 アニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラザン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、ターシャリーブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸
15 塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(6)で表される化合物に対して1~4当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100
25 時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(6)で表される化合物1当量に対して1~10当量の一般式(7)で表される化合物を用い、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリルやジメチルホルムアミド等の極性溶媒中、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムターシャリーブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチル

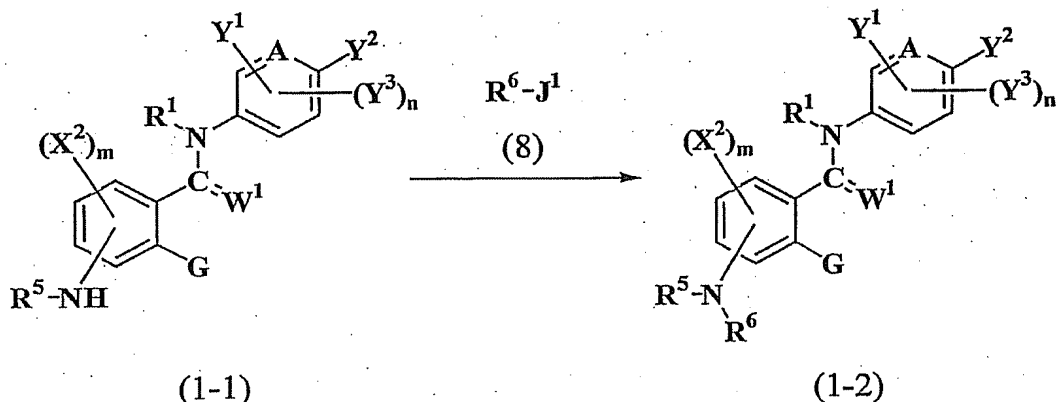
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

77

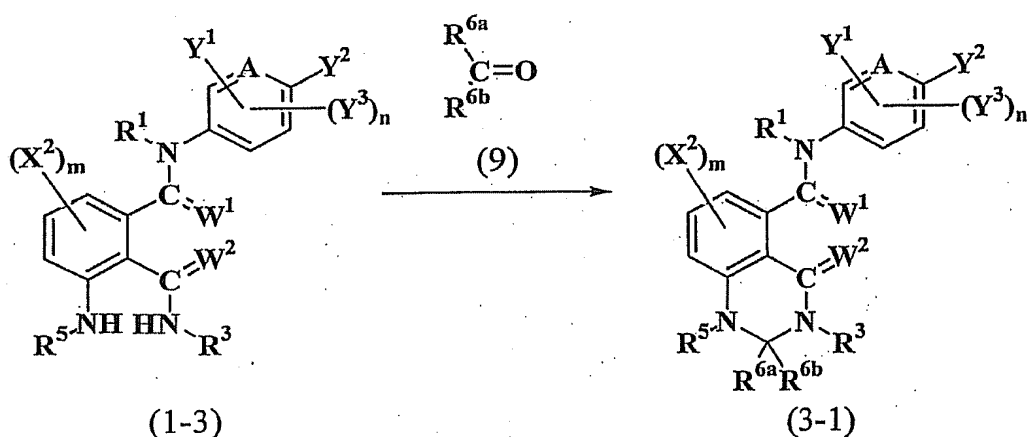
アミンやピリジン等を一般式 (6) で表される化合物 1 当量に対して 1 ~ 3 当量用いて、0 ~ 90℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 B



一般式 (1) において X¹ が -NHR⁵ である一般式 (1-1) [式中、A、G、W¹、X²、Y¹、Y²、Y³、R¹、R⁵、m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と、一般式 (8) [式中、R⁶ 及び J¹ は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において X¹ が -N(R⁶)R⁵ である本発明化合物 (1-2) [式中、A、G、W¹、X²、Y¹、Y²、Y³、R¹、R⁵、R⁶、m 及び n は前記と同じ意味を表す。] を得ることができる。

10 製造法 C



一般式 (1) において G が G-1 且つ R² が水素原子であり、X¹ が -NHR⁵ である一般式 (1-3) [式中、A、W¹、W²、X²、Y¹、Y²、Y³、R¹、R³、R⁵、m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と、一般式 (9) [式中、R^{6a} 及び R^{6b} は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、必要ならば触媒の存在下、必要ならば該反応に対して

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

78

不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(3)において α が0である一般式(3-1) [式中、 A , W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , R^{6a} , R^{6b} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

5 反応基質の量は、一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して1~100当量の一般式(9)で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、
10 四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、 N -メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、 N,N -ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸等の鉱酸類、ギ酸、
20 酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、 p -トルエンスルホン酸等の有機酸類、トリエチルアミン塩酸塩、ピリジン塩酸塩等のアミン類の酸付加塩、塩化亜鉛、ヨウ化亜鉛、四塩化チタン、塩化セリウム、イッテルビウムトリフレート、三フッ化ホウ素-エーテル錯体等のルイス酸を、一般式(1-3)で表される化合物に対して0.001~1当量用いることができる。

25 反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して1~10当量の一般式(9)で表される化合物を用い、ベンゼン、トルエン、メタノール、エタノール、

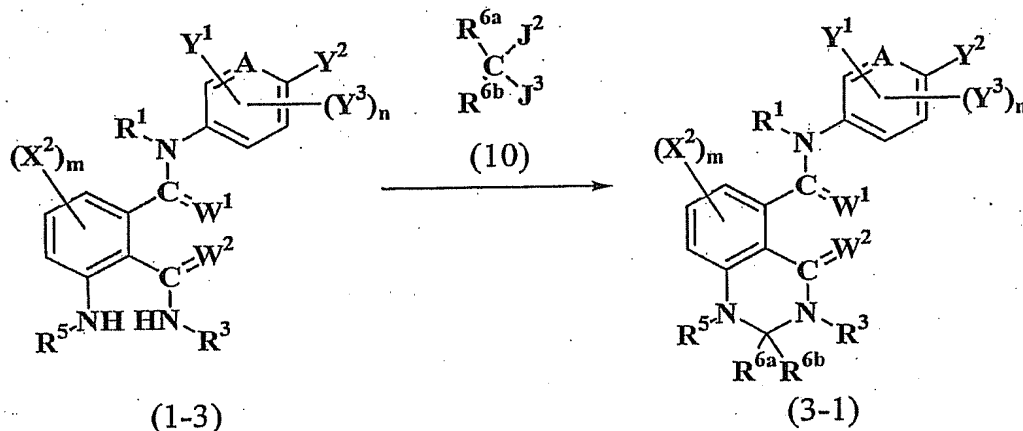
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

79

ギ酸又は酢酸等の溶媒を用いるか、溶媒量の一般式(9)で表される化合物を用い、濃塩酸又はp-トルエンスルホン酸等の触媒を一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して0.01~0.1当量用いて、50~180℃の温度範囲で、30分から24時間反応を行なうのが好ましい。

5 製造法D



一般式(1)においてGがG-1且つR²が水素原子であり、X¹が-NHR⁵である一般式

(1-3) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R¹, R³, R⁵, m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と、一般式(10) [式中、R^{6a}及びR^{6b}は前記と同じ意味を表し、J²及びJ³は互いに同一でも又は互いに相異なってもよく、塩素原子、臭素原子、

10 ヨウ素原子、C₁~C₄アルコキシ基(例えば、メトキシ基、エトキシ基)等を表す。] で表される化合物とを、必要ならば塩基又は触媒の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(3)においてoが0である一般式

(3-1) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R¹, R³, R⁵, R^{6a}, R^{6b}, m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

15 反応基質の量は、一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して1~50当量の一般式(10)で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては製造法Cに記載したものと同様の溶媒を用いることができる。

塩基を用いる場合、用いられる塩基としては製造法Aに記載したものと同様の塩基を

20 用いることができる。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては製造法Cに記載したものと同様の触媒を用い

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

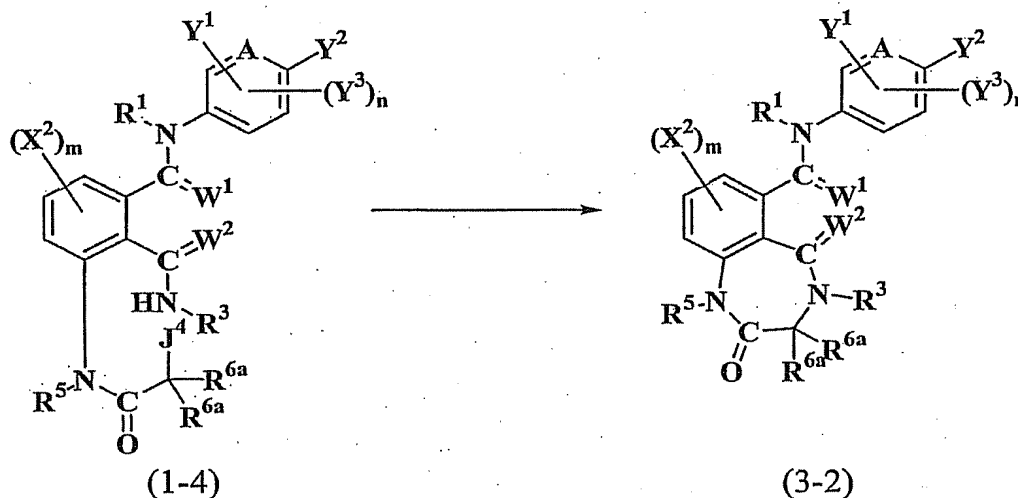
80

ることができる。

反応温度は -60°C から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

- 5 一般的には、例えば一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して1~10当量の一般式(10)で表される化合物を用い、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン又は1,4-ジオキサン等の溶媒を用い、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムターシャリーブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミンやピリジン等を一般式(1-3)で表さ
- 10 れる化合物1当量に対して1~3当量用いて、 $0\sim 90^{\circ}\text{C}$ の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 E



一般式(1)においてGがG-1且つR²が水素原子であり、X¹が

$-\text{N}(\text{R}^5)\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{R}^{6a})(\text{R}^{6b})\text{J}^4$ である一般式(1-4) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R¹, R³,

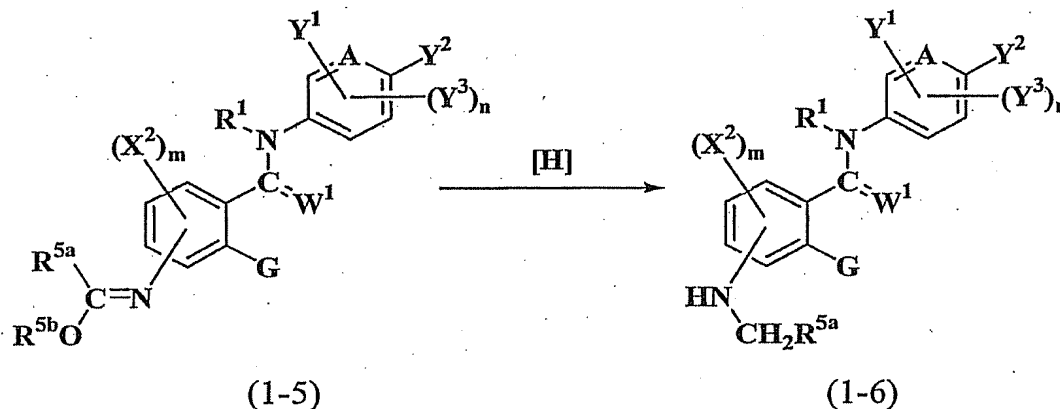
- 15 R⁵, R^{6a}, R^{6b}, m及びnは前記と同じ意味を表し、J⁴がハロゲン原子を表す。]で表される本発明化合物を、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(3)においてoが1である一般式(3-2) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R¹, R³, R⁵, R^{6a}, R^{6b}, m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。

- 20 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては製造法Aに記載したものと同様の溶媒を

反応温度は -60°C から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-4)で表される化合物1当量に対して、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムターシャリーブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミンやピリジン等を1~3当量使い、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン又は1,4-ジオキサン等の溶媒を用い室温~90℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 F



一般式(1)において X^1 が X^1-2 である一般式(1-5)〔式中、 A , G , W^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^{5a} , R^{5b} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を、必要ならば触媒の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム等の水素化剤と反応させることにより、一般式(1)において X^1 が $-NHCH_2R^{5a}$ である一般式(1-6)〔式中、 A , G , W^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^{5a} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式（1-5）で表される化合物 1 当量に対して 1 ～ 100 当量の

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

82

水素化剤を用いることができる。

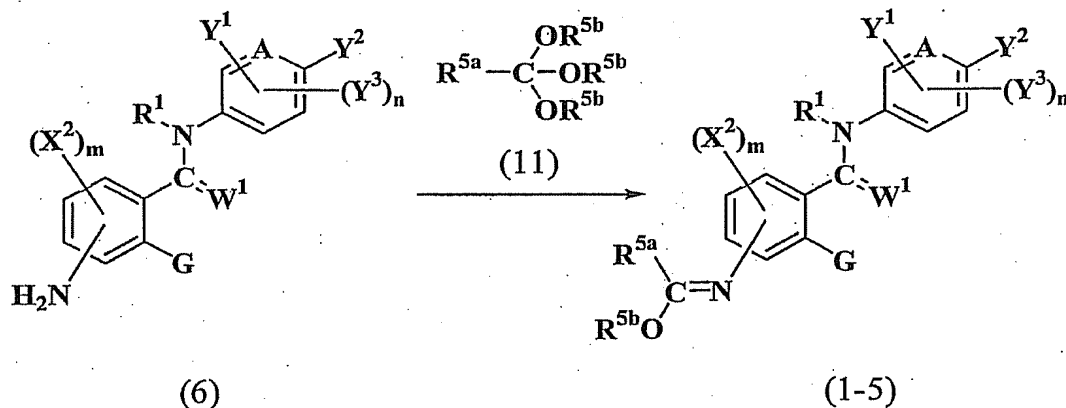
溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸等の鉱酸類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸、塩化亜鉛、四塩化チタン、塩化セリウム、イッテルビウムトリフレート、三フッ化ホウ素-エーテル錯体等のルイス酸を、一般式(1-5)で表される化合物に対して0.001~1当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-5)で表される化合物1当量に対して1~10当量のシアノ水素化ホウ素ナトリウムを用い、酢酸中、0~90℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 G



一般式(6) [式中、A, G, W¹, X², Y¹, Y², Y³, R¹, m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(1-5) [式中、R^{5a} 及び R^{5b} は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、必要ならば触媒の存在下、必要ならば該反応に対して不

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

83

活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(1)において X^1 が X^{1-2} である一般式(1-5) [式中、A、G、 W^1 、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

5 反応基質の量は、一般式(6) で表される化合物1当量に対して1～100当量の一般式(11) で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、
10 四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等
15 が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては製造法Cに記載したものと同様の触媒を用いることができる。
20

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

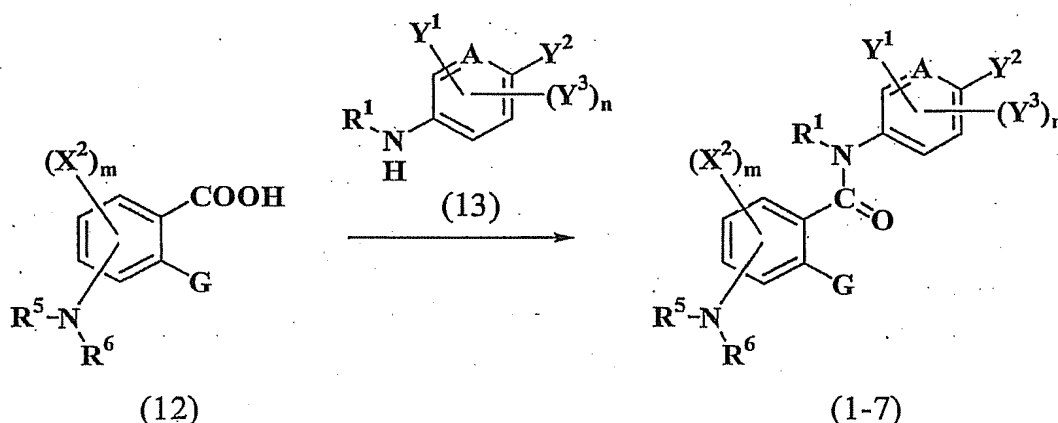
一般的には、例えば一般式(6) で表される化合物1当量に対して1～10当量の一般式(11) で表される化合物を用い、無溶媒か、又はベンゼン、トルエン等の溶媒を用い、p-トルエンスルホン酸等の触媒を一般式(6) で表される化合物1当量に対して0.01～0.1当量用いて、50～150℃の温度範囲で、30分から24時間反応を行なうのが好ましい。
25

製造法H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

84



- 一般式 (12) [式中、G、 X^2 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (13) [式中、A、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを該反応に対して不活性な溶媒中、又は無溶媒にて、必要ならば塩基の存在下、縮合剤を用いて反応させることにより、一般式 (1) において X^1 が X^1-1 であり、 W^1 が酸素原子である一般式 (1-7) [式中、A、G、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 、 R^5 、 R^6 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式 (12) で表される化合物 1 当量に対して 1 ~ 1.00 当量の一般式 (13) で表される化合物を用いることができる。

- 縮合剤は、通常のアミド合成に使用されるものであれば特に制限はないが、例えば向山試薬 (2-クロロ-N-メチルピリジニウム アイオダイド)、DCC (1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド)、WSC (1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド 塩酸塩)、CDI (カルボニルジイミダゾール)、ジメチルプロピニルスルホニウム ブロマイド、プロパルギルトリフェニルホスホニウム ブロマイド、DEPC (シアノ磷酸ジエチル) 等を、一般式 (12) で表される化合物に対して 1 ~ 4 当量用いることができる。

- 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

85

ピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、アセトニトリル及びジメチルスルホキシド等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2
5 種類以上を混合して用いてもよい。

塩基の添加は必ずしも必要ではないが、塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミ
10 ダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(12)で表される化合物に対して1~4当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100
時間の範囲で任意に設定できる。

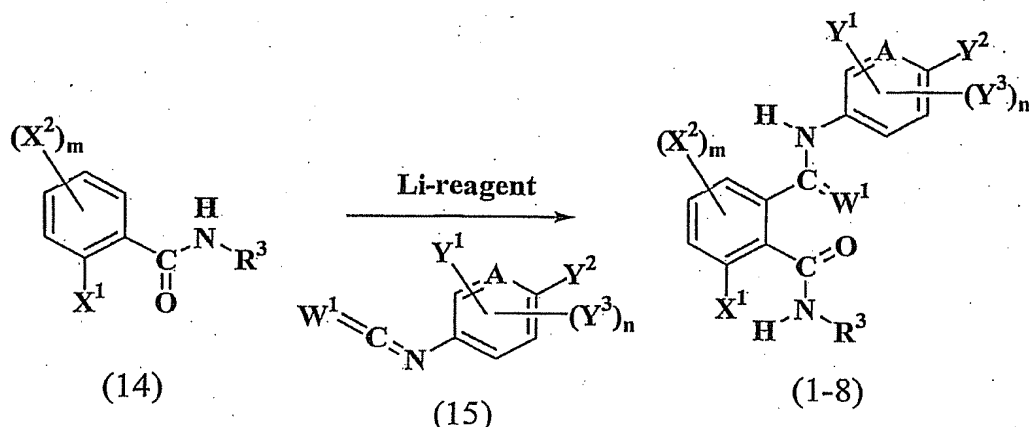
15 一般的には、例えば一般式(12)で表される化合物1当量に対して1~20当量の一般式(13)で表される化合物及び1~4当量のWSC(1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド 塩酸塩)、CDI(カルボニルジイミダゾール)等の縮合剤を用い、必要ならば1~4当量の炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基存在下にて、無溶媒か、又はジクロロメタン、クロロホルム、
20 ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等の溶媒を用い、0℃からこれらの溶媒の還流温度の範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 I

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

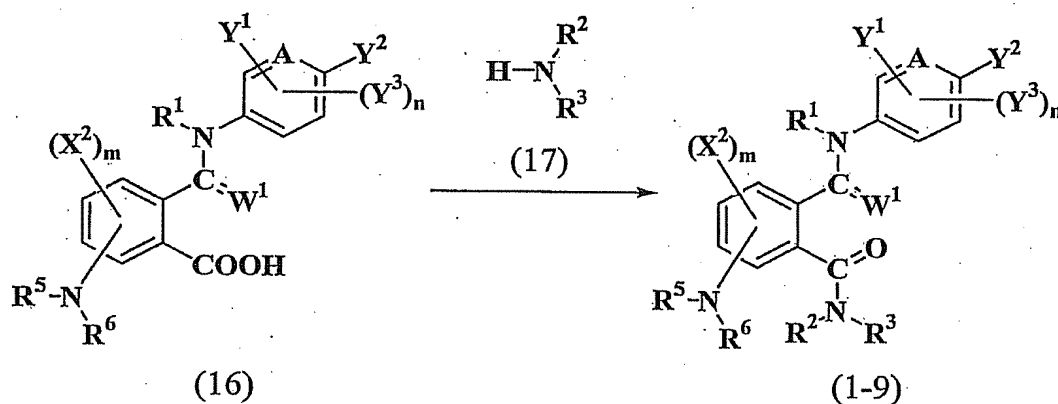
86



一般式 (14) [式中、 X^1 , X^2 , R^3 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えばケミカル・レビューズ [Chem. Rev.] 1990年、90巻、879頁等に記載の方法に準じて、位置選択的メタル化後、一般式 (15)

[式中、 A , W^1 , Y^1 , Y^2 , Y^3 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と反応させることにより、一般式 (1) において G が $G-1$ 且つ R^2 が水素原子であり、 W^2 が酸素原子であり、 R^1 が水素原子である一般式 (1-8) [式中、 A , W^1 , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法 J



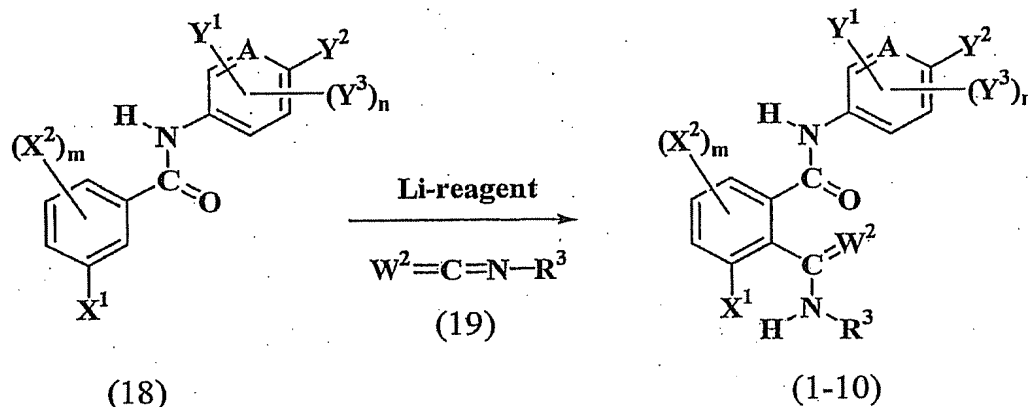
一般式 (16) [式中、 A , W^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^5 , R^6 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (17) [式中、 R^2 及び R^3 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 H と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において X^1 が X^1-1 であり、 G が $G-1$ であり、 W^2 が酸素原子である一般式 (1-9) [式中、 A , W^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

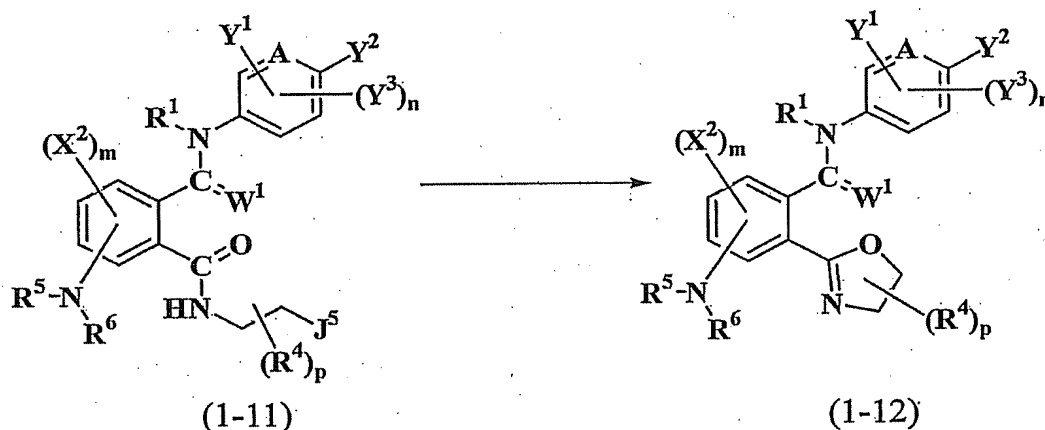
87

製造法 K



- 一般式 (18) [式中、 A , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (19) [式中、 W^2 及び R^3 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 I と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において G が $G-1$ 且つ R^2 が水素原子であり、 W^1 が酸素原子であり、 R^1 が水素原子である一般式 (1-10) [式中、 A , W^2 , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法 L



- 一般式 (1-11) [式中、 W^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , m , n 及び p は前記と同じ意味を表し、 J^5 はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート基 (例えば、メタンスルホニルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネート基 (例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基) 又はアールルスルホネート基 (例えば、ベンゼンスルホニルオキシ基、 p -トルエンスルホニルオキシ基) のような良好な脱離基を表す。] で表される本発明化合物を、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

88

反応に対して不活性な溶媒を用いて環化させることにより、一般式 (1) において X^1 が X^1-1 であり、 G が $G-2$ であり、 W^2 が酸素原子である一般式 (1-1 2) [式中、 W^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , m , n 及び p は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

- 5 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1, 2-ジメ
10 トキシエタン、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、 N -メチル-2-ピロリドン等のアミド類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン及び1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン
15 等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

- 塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金
20 属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、 N, N -ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1, 8-ジアザビシクロ [5, 4, 0] -7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式 (1-7) で表される化合物に対して1~4当量用いることができる。

- 反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100
25 時間の範囲で任意に設定できる。

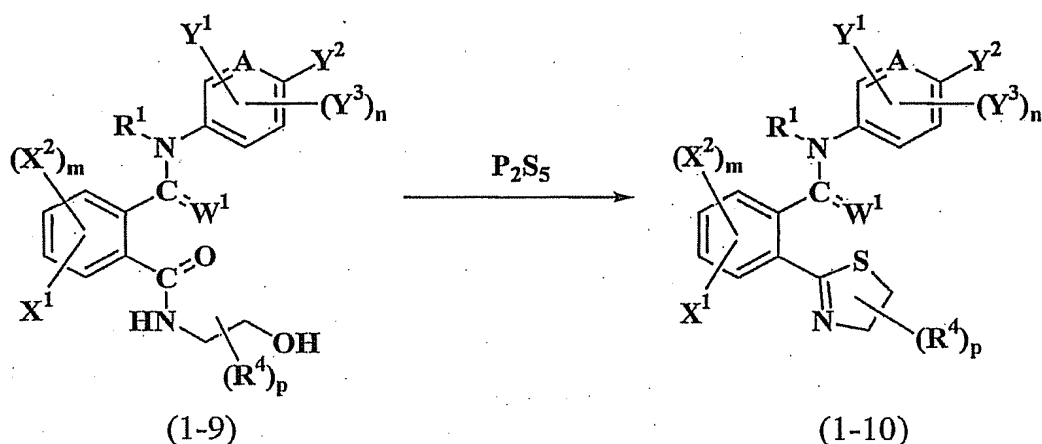
一般的には、例えば一般式 (1-1 1) で表される化合物を溶媒量のピリジン中、0~90℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 M

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

89



一般式 (1-13) [式中、 W^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , m , n 及び p は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、例えば五硫化二リンのような硫化剤と反応させることにより、一般式 (1) において X^1 が X^1-1 であり、 G が $G-2$ であり、 W^2 が硫黄原子である一般式 (1-14) [式中、 W^1 , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , m , n 及び p は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては製造法 L に記載したものと同一ものを用いることができる。

反応温度は 0℃ から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、
 10 反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常 5 分から 100 時間の範囲で任意に設定できる。

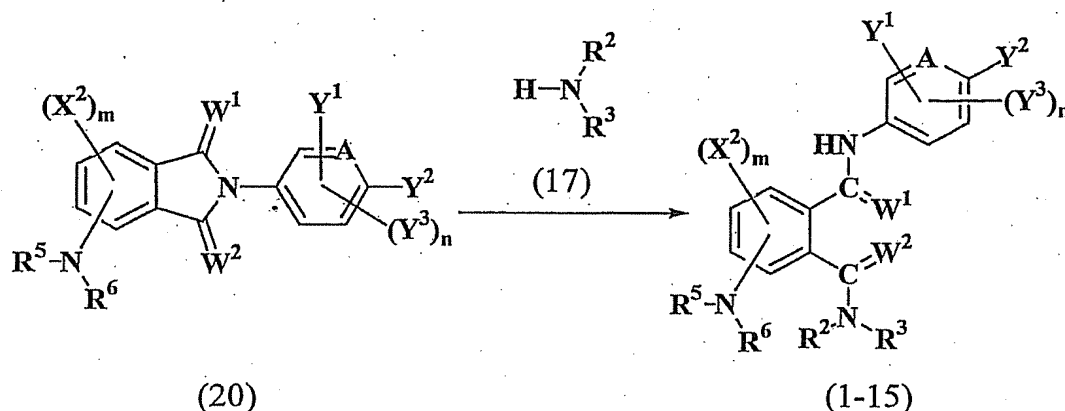
一般的には、例えば一般式 (1-13) で表される化合物 1 当量に対して 1～5 当量の五硫化二リンを用い、トルエン等の溶媒中、室温～90℃ の温度範囲で、10 分から 24 時間反応を行なうのが好ましい。

15 製造法 N

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

90



一般式(20) [式中、A、W¹、W²、X²、Y¹、Y²、Y³、R⁵、R⁶、m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(17) [式中、R²及びR³は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを該反応に対して不活性な溶媒中、又は無溶媒にて、必要ならば触媒の存在下、反応させることにより、一般式(1)においてR¹が水素原子であり、X¹がX¹-1であり、GがG-1である、一般式(1-15) [式中、A、W¹、W²、X²、Y¹、Y²、Y³、R²、R³、R⁵、R⁶、m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式(20)で表される化合物1当量に対して1～50当量の一般式(17)で表される化合物を用いることができる。

- 10 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノ
- 15
- 20

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

91

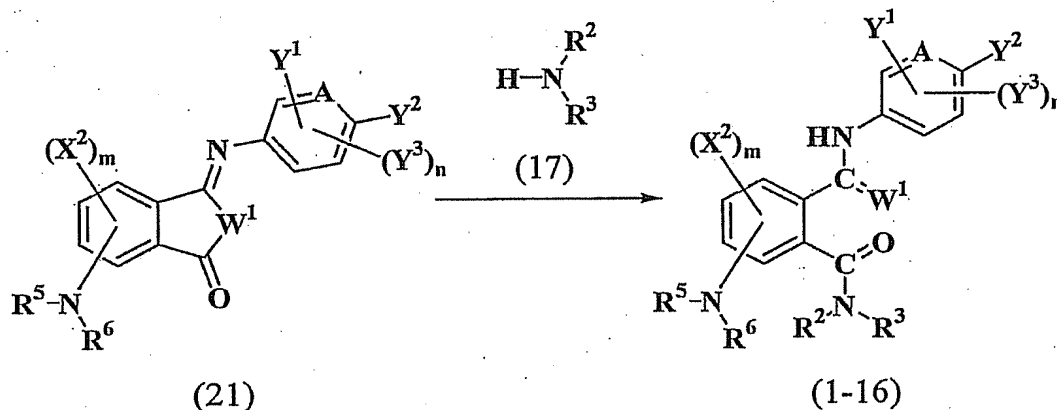
ン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては製造法Cに記載したものと同一ものを、一般式(20)で表される化合物に対して0.001~1当量用いることができる。

- 5 反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができる、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

- 一般的には、例えば一般式(20)で表される化合物1当量に対して1~10当量の一般式(17)で表される化合物を用い、無溶媒か、又はテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等の溶媒を用い、50℃から反応混合物の還流温度の温度範囲で、30分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法D



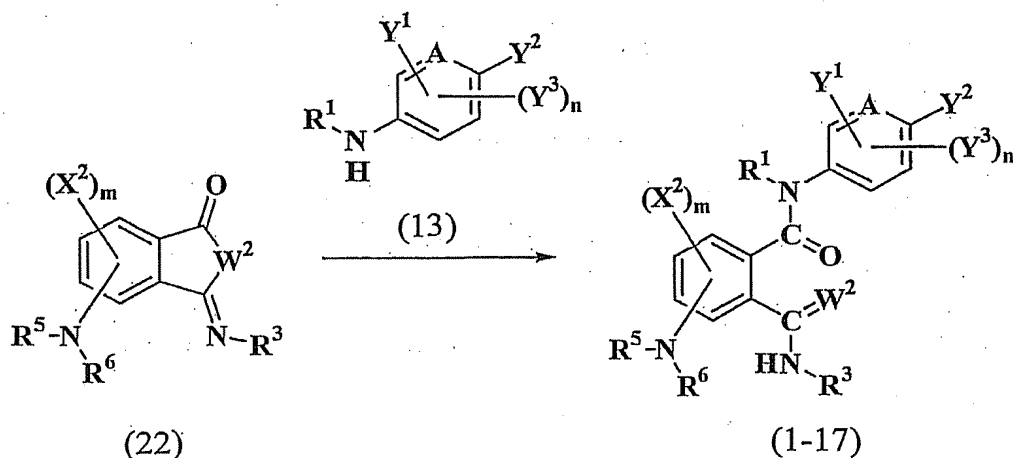
- 一般式(21) [式中、A、W¹、X²、Y¹、Y²、Y³、R⁵、R⁶、m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と、一般式(17) [式中、R²及びR³は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法Nと同様な条件下反応させることにより、一般式(1)においてX¹がX¹-1であり、GがG-1であり、W²が酸素原子であり、R¹が水素原子である一般式(1-16) [式中、A、W¹、X²、Y¹、Y²、Y³、R²、R³、R⁵、R⁶、m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法P

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

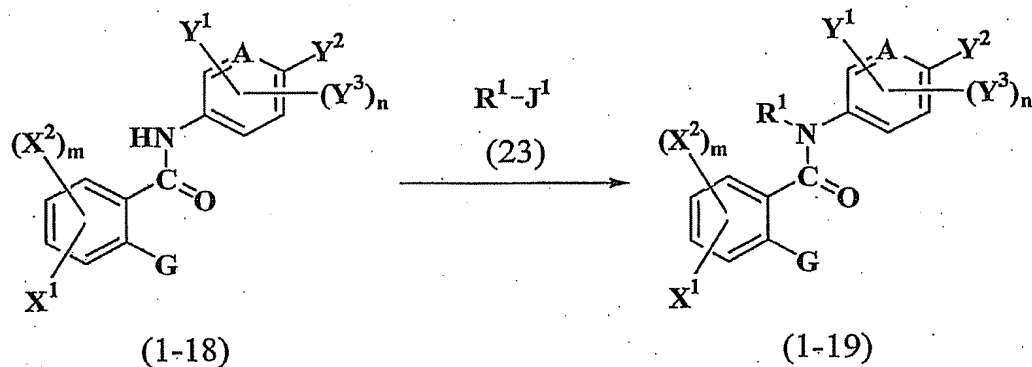
92



一般式 (22) [式中、 W^2 , X^2 , R^3 , R^5 , R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (13) [式中、 A , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 N と同様な条件下反応させることにより、一般式

(1) において X^1 が X^1-1 であり、 G が $G-1$ であり、 W^2 が酸素原子であり、 R^2 が水素原子である一般式 (1-17) [式中、 A , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , R^6 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法 Q



一般式 (1) において W^1 が酸素原子であり、 R^1 が水素原子である一般式 (1-18)

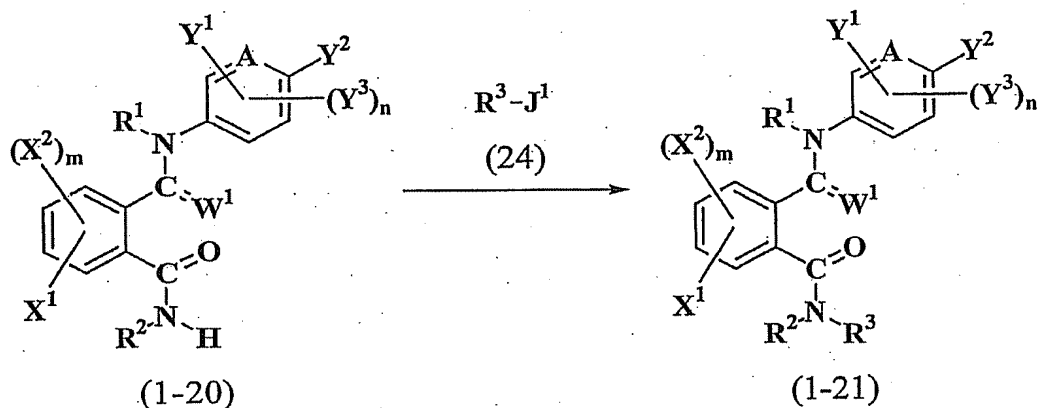
[式中、 A , G , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と、一般式 (23) [式中、 R^1 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において W^1 が酸素原子である一般式 (1-19) [式中、 A , G , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法 R

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

93

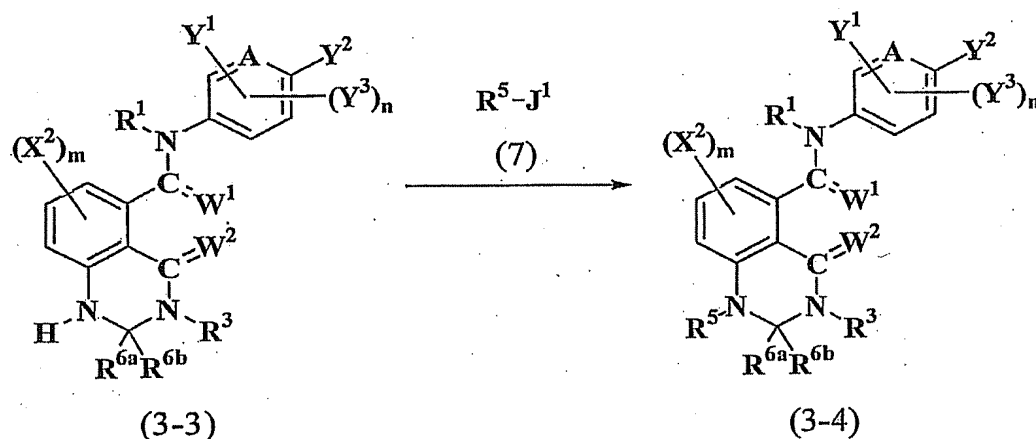


一般式 (1) において W^2 が酸素原子であり、 R^3 が水素原子である一般式 (1-20)

[式中、 A , W^1 , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^2 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と、一般式 (24) [式中、 R^3 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) に

5 おいて W^2 が酸素原子である一般式 (1-21) [式中、 A , W^1 , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^2 , R^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法 S



一般式 (3) において R^5 が水素原子であり、 o が 0 である一般式 (3-3) [式中、 A , W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^{6a} , R^{6b} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表され

10 る本発明化合物と、一般式 (7) [式中、 R^5 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (3) において o が 0 である一般式 (3-4) [式中、 A , W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , R^{6a} , R^{6b} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製法 A~製法 S において、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮、又は有機溶媒に溶解

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

94

し、水洗後濃縮、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった通常の後処理を行ない、目的の本発明化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

- 5 製造法 A 及び製造法 G において本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式 (6) で表される化合物の或るものはヨーロッパ特許出願公報 (EP 0, 919, 542 号公報)、国際特許出願公報 (WO 01/00599 号公報、WO 01/02354 号公報) 等に記載の公知化合物であり、また、それ以外のものも、これらの合成方法及び文献記載のアニリン誘導体の一般的な合成方法に準じて合成することができる。
- 10 製造法 A 及び製造法 S における一般式 (7) で表される化合物、製造法 B における一般式 (8) で表される化合物、製造法 Q における一般式 (23) で表される化合物及び製造法 R における一般式 (24) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な合成方法、例えばケミストリー・レターズ [Chem. Lett.] 1976 年、373 頁、テトラヘドロ
- 15 ン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1972 年、4339 頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1976 年、41 巻、4028 頁及び 1978 年、43 巻、3244 頁、オーガニック・シンセシス [Org. Synth.] 1988 年、コレクティブボリューム 6 巻、101 頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1964 年、86 巻、4383 頁、英国特許
- 20 (GB 2, 161, 802 号公報)、ヨーロッパ特許 (EP 0, 051, 273 号公報) 等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

- 製造法 C における一般式 (9) で表される化合物及び製造法 D における一般式 (10) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のアルデヒド類、ケトン類、アセタール類及びケター
- 25 ル類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

製造法 G における一般式 (11) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のカルボン酸オルソエステル類の一般的な合成方法、例えば、ケミストリー・レターズ [Chem. Lett.] 1976 年、891 頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J.

WO 03/011028

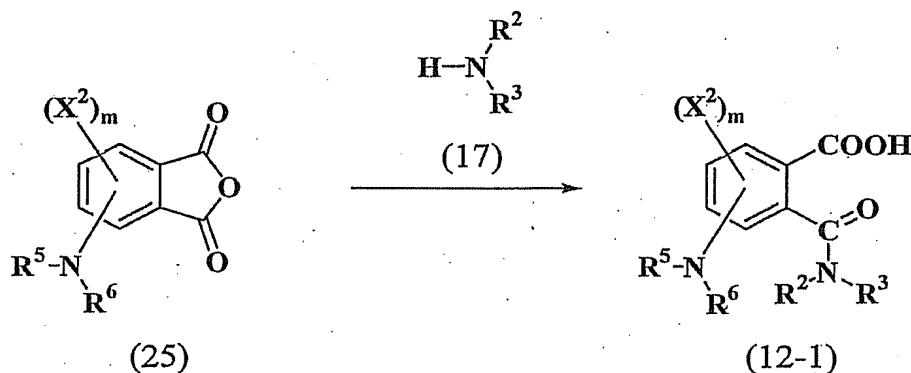
PCT/JP02/07833

95

Am. Chem. Soc.] 1942年、64巻、1825頁及び1955年、77巻、4571頁、
ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1980年、4
5巻、740頁等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

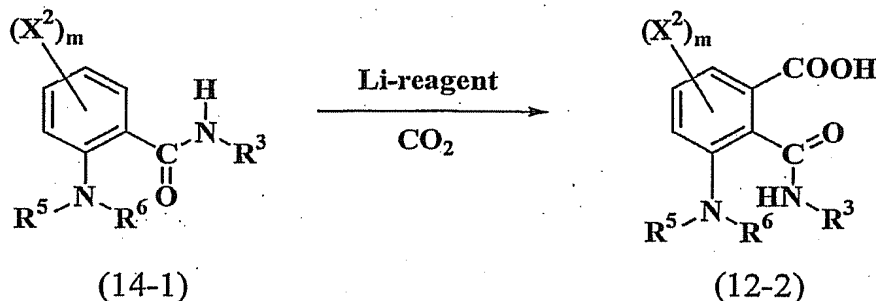
製造法Hにおいて、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(1
5 2)で表される化合物は、例えば下記の反応式1～反応式3で表される方法等を用いて
合成することができる。

反応式1



一般式(25) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と、一般式(17) [式中、 R^2 及び R^3 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物
10 とを、製造法Nと同様な条件下反応させることにより、一般式(12)においてGがG-1
であり、 W^2 が酸素原子である一般式(12-1) [式中、 X^2 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 及び m は前記
と同じ意味を表す。]で表される化合物を得ることができる。

反応式2



一般式(14)において X^1 が X^1-1 である一般式(14-1) [式中、 X^2 , R^3 , R^5 , R^6 及
15 び m は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えば、
ケミカル・レビューズ [Chem. Rev.] 1990年、90巻、879頁等に記載の方法に準
じて、位置選択的メタル化後、炭酸ガスと反応させることにより、一般式(12)にお

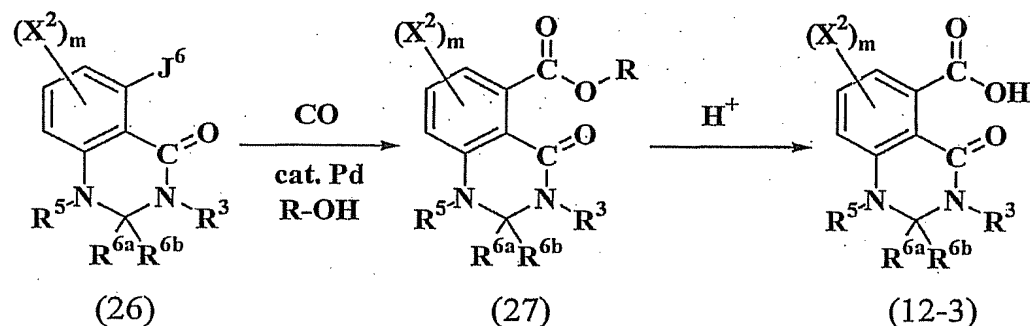
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

96

いて G が G-1 且つ R² が水素原子であり、W² が酸素原子である一般式 (12-2) [式中、X², R³, R⁵, R⁶ 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

反応式 3



- 一般式 (26) [式中、X², R³, R⁵, R^{6a}, R^{6b} 及び m は前記と同じ意味を表し、J⁶ は臭素原子、ヨウ素原子、フルオロスルホニルオキシ基又はトリフルオロメタンスルホニルオキシ基を表す。] で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1991年、56巻、4320頁及び1994年、59巻、1216頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1992年、33巻、1959頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、
- 一般式 (27) [式中、X², R³, R⁵, R^{6a}, R^{6b} 及び m は前記と同じ意味を表し、R はメチル基又はエチル基等の低級アルキル基を表す。] で表される化合物をうることができる。
- この一般式 (27) で表されるカルボン酸エステル誘導体は、一般的な加水分解反応条件下、容易に一般式 (12-3) [式中、X², R³, R⁵, R^{6a}, R^{6b} 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表されるカルボン酸に変換することができる。
- 製造法 H 及び製造法 P における一般式 (13) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のアニリン類の一般的な合成方法、例えばアンゲバンテ・ヘミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ [Angew. Chem. Int. Ed. Engl.] 1985年、24巻、871頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1964年、29巻、1頁及び1965年、30巻、1001頁、シンセシス [Synthesis] 1984年、667頁、日本化学会誌 1973年、2351頁、ドイツ国特許 (DE 2606982 号公報)、日本国特許 (特開平 1-90163 号公報) 等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

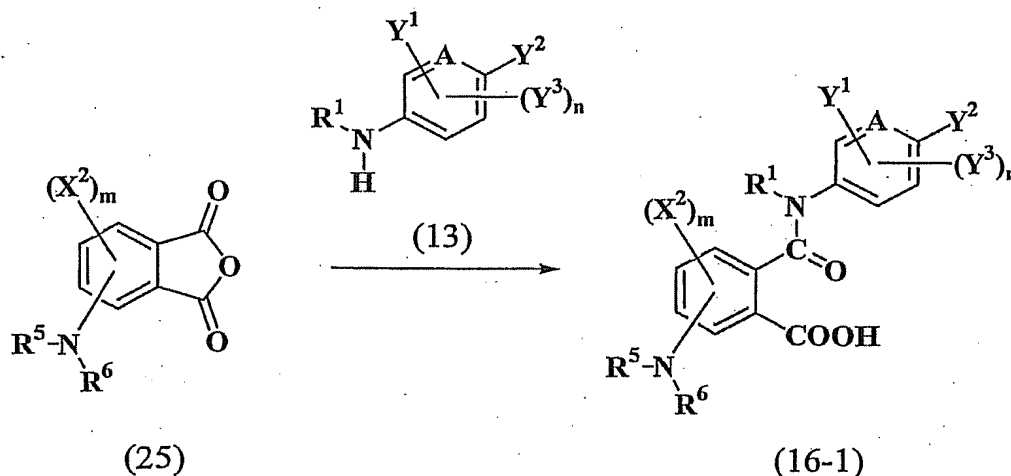
97

製造法 I における一般式 (14) で表される化合物の或るものは国際特許出願公報 (WO 98/23581 号公報、WO 01/70671 号公報) 等に記載の公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものもこれらの合成方法及び文献記載の公知の方法、例えばテトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1994 年、35 巻、2113 頁に記載の方法等に準じて容易に合成することができる。

製造法 I における一般式 (15) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のイソシアネート類の一般的な合成方法、例えばアンゲバンテ・ヘミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ [Angew. Chem. Int. Ed. Engl.] 1987 年、26 巻、894 頁及び 1995 年、34 巻、2497 頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1976 年、41 巻、2070 頁、シンセシス [Synthesis] 1988 年、990 頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1997 年、38 巻、919 頁等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

製造法 J において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式 (16) で表される化合物は、例えば下記の反応式 4 又は反応式 5 で表される方法等を用いて合成できる。

反応式 4



一般式 (25) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (13) [式中、 A , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表

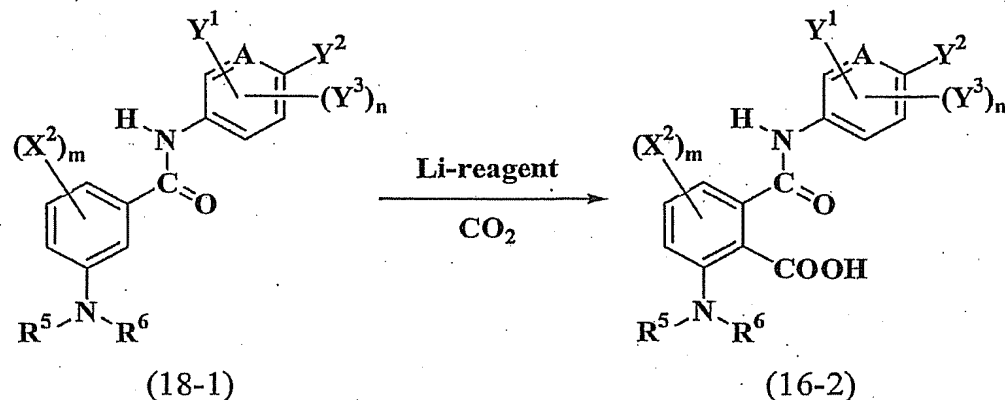
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

98

される化合物とを、製造法 N と同様な条件下反応させることにより、一般式 (16) において W¹ が酸素原子である一般式 (16-1) [式中、A, X², Y¹, Y², Y³, R⁵, R⁶, m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

反応式 5



- 5 一般式 (18) において X¹ が X¹-1 である一般式 (18-1) [式中、A, X², Y¹, Y², Y³, R⁵, R⁶, m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えば、ケミカル・レビューズ [Chem. Rev.] 1990 年、90 巻、879 頁等に記載の方法に準じて、位置選択的メタル化後、炭酸ガスと反応させることにより、一般式 (16) において X¹ が X¹-1 であり、W¹ が酸素原子である一般式 (16-2) [式中、A, X², Y¹, Y², Y³, R⁵, R⁶, m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。
- 10

製造法 J、製造法 N 及び製造法 O における一般式 (17) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも、例えばケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレイティン [Chem. Pharm. Bull.] 1982 年、30 巻、1921 頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1986 年、108 巻、3811 頁、国際特許出願公報 (WO 01/23350 号公報) 等に記載の方法及び文献記載のその他 1 級又は 2 級アルキルアミン類それぞれの一般的な合成方法に準じて合成することができる。

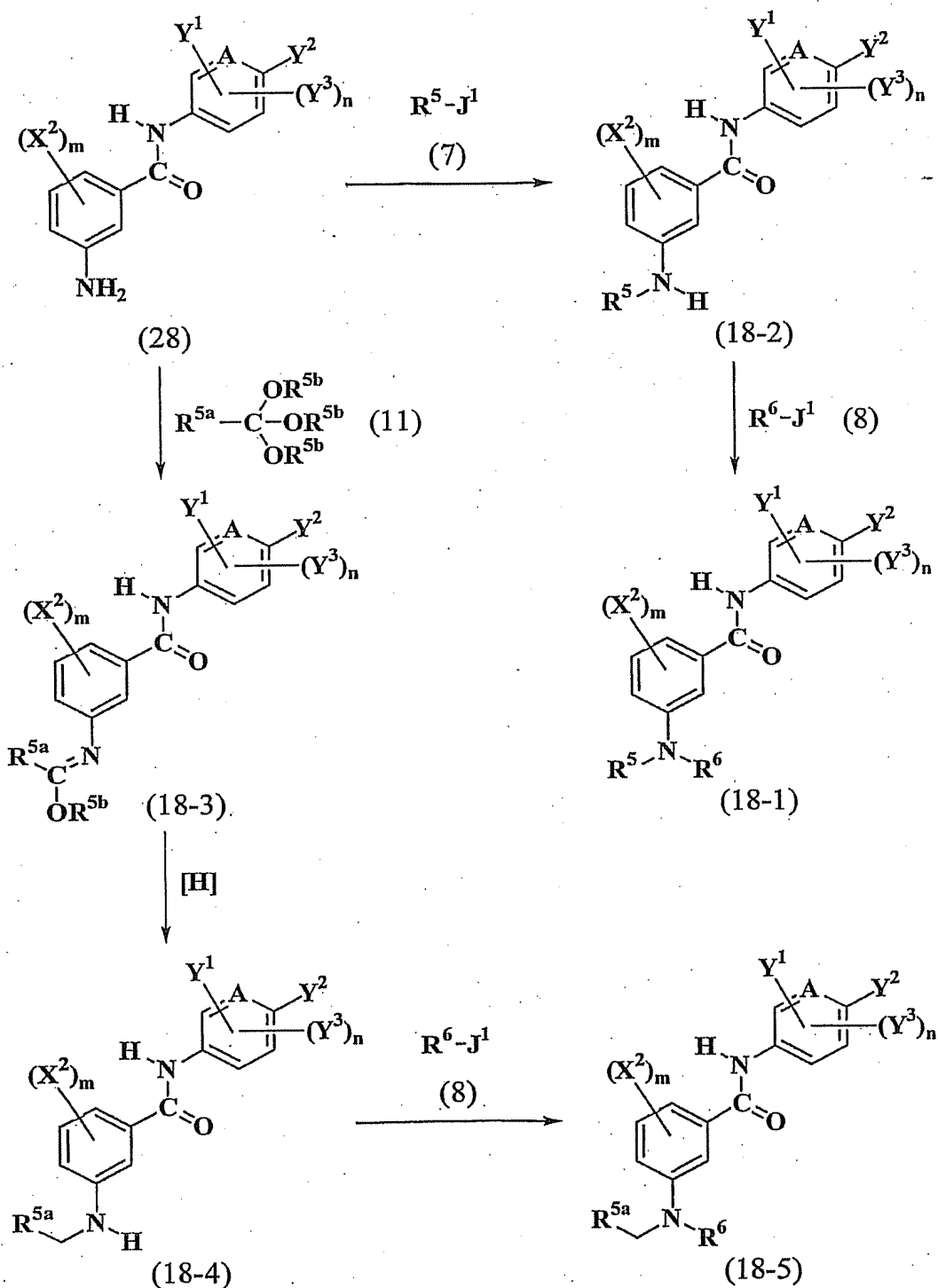
- 製造法 K において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式 (18) で表される化合物は、例えば下記の反応式 6 又は反応式 7 で表される方法等を用いて合成できる。
- 20

反応式 6

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

99



すなわち、一般式 (28) [式中、 A 、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、製造法 A、製造法 B、製造法 F 及び製造法 G と同様な条件下反応させることにより、一般式 (18-1)、(18-2)、(18-3)、(18-4)

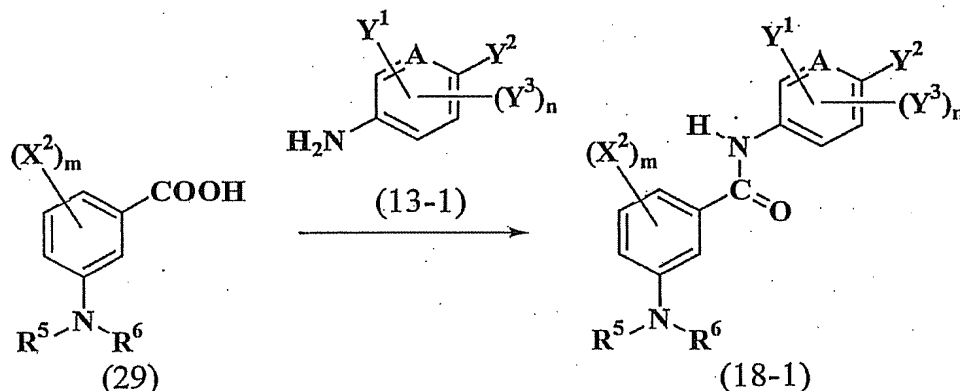
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

100

及び(18-5) [各式中、A、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^5 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、 R^6 、m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

反応式7



- 一般式(29) [式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(13)において R^1 が水素原子である一般式(13-1) [式中、A、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法Hと同様な条件下反応させることにより、一般式(18)において X^1 が X^1-1 である一般式(18-1) [式中、A、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^5 、 R^6 、m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

- 製造法Kにおける一般式(19)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のイソシアネート類の一般的な合成方法、例えばアンゲバンテ・ヘミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ [Angew. Chem. Int. Ed. Engl.] 1995年、34巻、22頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1970年、35巻、51頁及び1996年、61巻、3883頁、シンセシス [Synthesis] 1987年、907頁及び1988年、990頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1993年、34巻、3559頁及び1998年、39巻、3749頁等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

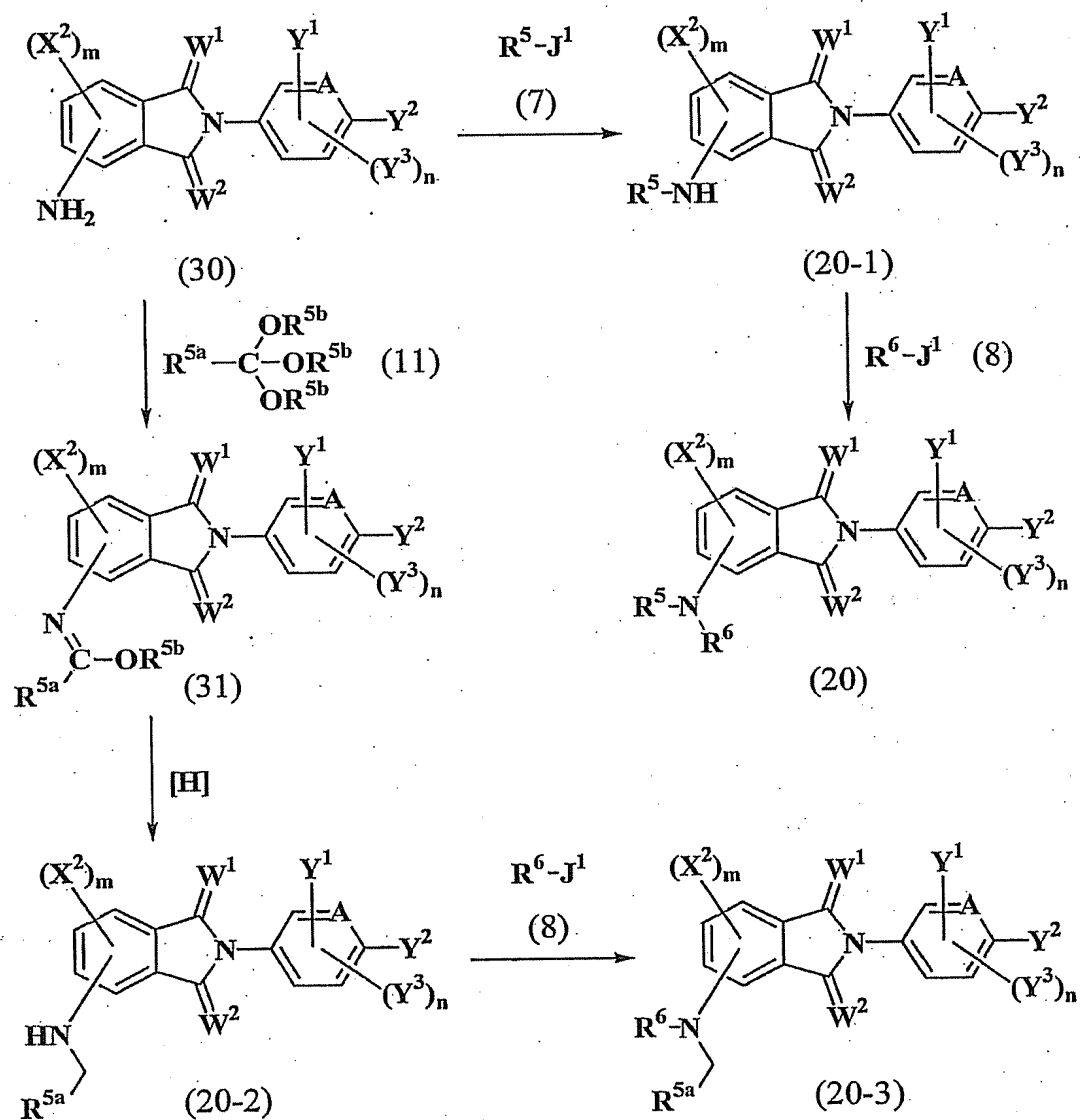
- 製造法Nにおいて、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(20)で表される化合物は、例えば下記の反応式8又は反応式9で表される方法等を用いて合成することができる。

反応式8

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

101



一般式 (30) [式中、 A , W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、製造法 A、製造法 B、製造法 F 及び製造法 G と同様な条件下反応させることにより、一般式 (20)、(20-1)、(20-2) 及び (20-3)

[各式中、 A , W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^5 , R^{5a} , R^6 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。]

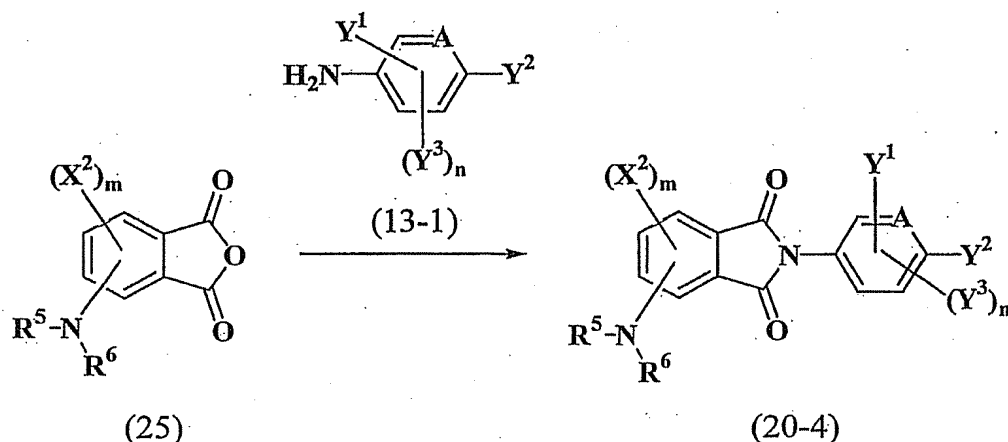
5 で表される化合物を得ることができる。

反応式 9

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

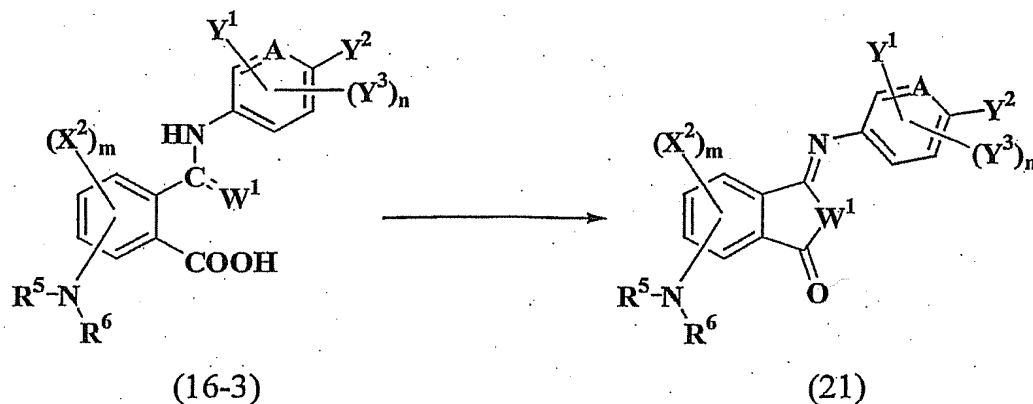
102



- 一般式 (25) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と一般式 (13) において R^1 が水素原子である一般式 (13-1) [式中、 A , Y^1 , Y^2 , Y^3 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、文献記載の公知の方法、例えばベリヒテ・デア・ドイッチェン・ヘミッシェン・ゲゼルシャフト [Ber. Dtsch. Chem. Ges.] 1907年、40巻、3177頁、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー [J. Chem. Soc.] 1954年、2023頁、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー・パーキン・トランスアクションズ、1 [J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1] 1994年、2975頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式 (20) において W^1 及び W^2 が酸素原子である一般式 (20-4) [式中、 X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^5 , R^6 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を容易に合成することができる。

製造法0において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式 (21) で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式10



WO 03/011028

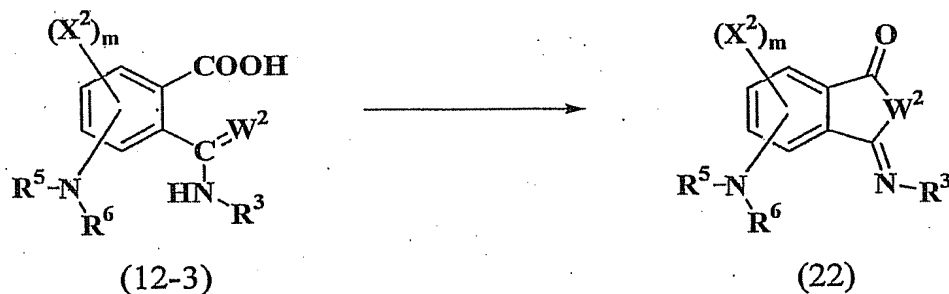
PCT/JP02/07833

103

すなわち、一般式(16)において R^1 が水素原子である一般式(16-3)〔式中、 A 、 W^1 、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^5 、 R^6 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物を、文献記載の一般的な脱水環化によるイソイミドの合成反応、例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.]1975年、97巻、5582頁、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー[J. Med. Chem.]1967年、10巻、982頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[J. Org. Chem.]1963年、28巻、2018頁等に記載の方法等に準じて環化することにより容易に合成することができる。

製造法Pにおいて、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(2)で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式11



すなわち、一般式(12)において X^1 が X^1-1 であり、 G が $G-1$ 且つ R^2 が水素原子である一般式(12-3)〔式中、 W^2 、 X^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物を、反応式10と同様に反応させることにより容易に合成することができる。

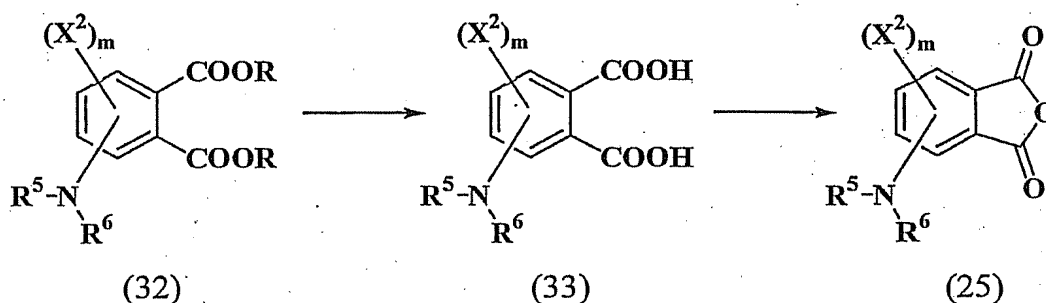
反応式1、反応式4及び反応式9で用いられる一般式(25)〔式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式12

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

104

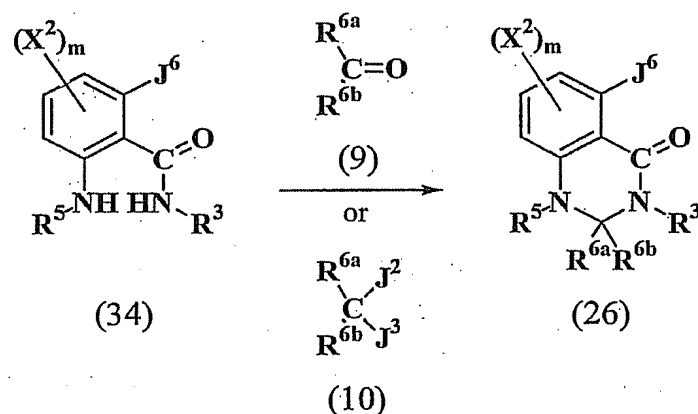


すなわち、一般式(32)〔式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル基、エチル基等の低級アルキル基を表す。〕で表される化合物を、文献記載の一般的な加水分解反応、例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエ

- 5 [Angew. Chem.] 1951年、63巻、329頁等に記載の方法に準じて一般式(33)〔式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。〕で表されるフタル酸誘導体とした後、文献記載の一般的な脱水環化反応、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1987年、52巻、129頁等に記載の方法に準じた条件下反応させることにより、一般式(25)で表される化合物を得ることができる。

- 10 反応式3で用いられる一般式(26)〔式中、 X^2 、 R^3 、 R^5 、 R^{6a} 、 R^{6b} 、 m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式13



すなわち、一般式(34)〔式中、 X^2 、 R^3 、 R^5 、 m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物と、一般式(9)〔式中、 R^{6a} 及び R^{6b} は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物又は一般式(10)〔式中、 R^{6a} 、 R^{6b} 、 J^2 及び J^3 は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物とを、製造法C又は製造法Dと同様な条件下反応させることに

15

WO 03/011028

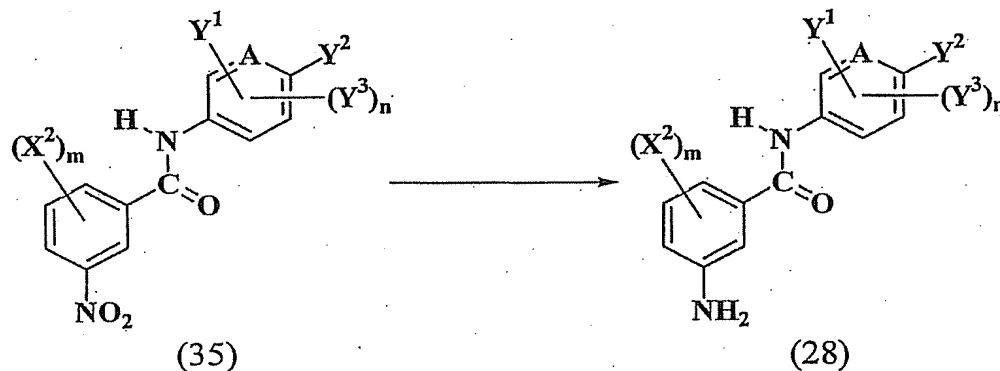
PCT/JP02/07833

105

より、一般式(26)で表される化合物を得ることができる。

反応式6で用いられる一般式(28)〔式中、A、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式14



- すなわち、一般式(35)〔式中、A、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物を、文献記載の一般的なニトロ基の還元反応、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1991年、34巻、2209頁等記載のパラジウム、プラチナ触媒等を用いた接触還元、例えばテトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1998年、39巻、201頁等記載のスズ、鉄等の低原子価金属塩を用いた還元、等に準じた条件下反応させることにより、一般式(28)で表される化合物を得ることができる。

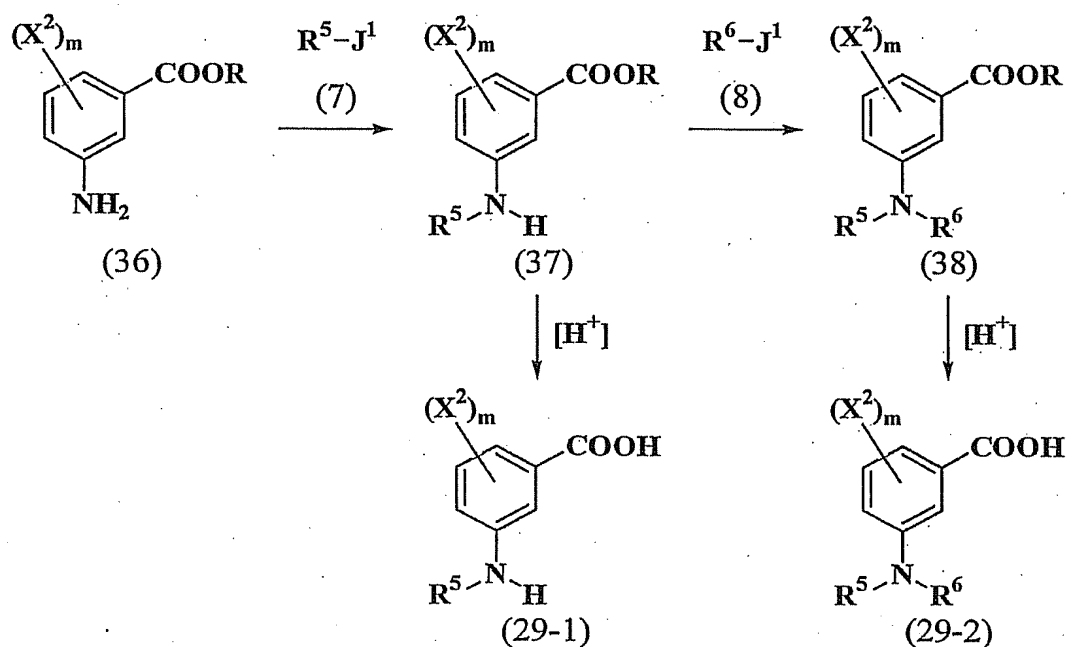
反応式7で用いられる一般式(29)〔式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも次のようにして容易に合成できる。

- 15 反応式15

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

106



すなわち、公知の一般式 (36) [式中、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル基、エチル基等の低級アルキル基を表す。] で表される化合物と、一般式 (7) [式中、 R^5 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (37) [式中、 X^2 、 R^5 、 m 及び R は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

さらに、この一般式 (37) で表される化合物と、一般式 (8) [式中、 R^6 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 B と同様な条件下反応させることにより、一般式 (38) [式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 、 m 及び R は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

このようにして得られた一般式 (37) 及び一般式 (38) で表される化合物は、通常の安息香酸エステル類の加水分解反応条件下、容易に一般式 (29-1) [式中、 X^2 、 R^5 及び m は前記と同じ意味を表す。] 及び一般式 (29-2) [式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される対応するカルボン酸誘導体に変換できる。

反応式 8 で用いられる一般式 (30) で表される化合物の或るものはヨーロッパ特許出願公報 (EP 0,919,542 号公報、EP 1,006,107 号公報、)、国際特許出願公報 (WO 01/00599 号公報、WO 01/21576 号公報) 等に記載の公知化合物であり、また、それ以外のものも、これらの合成方法及び文献記載のアニリン誘導体の一般的な合成方法に準じ

WO 03/011028

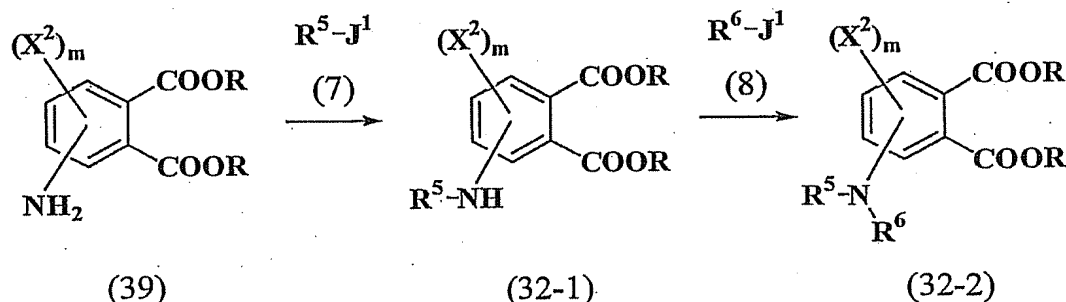
PCT/JP02/07833

107

て対応する置換フタル酸イミド誘導体から容易に合成することができる。

反応式 1 2 で用いられる一般式 (3 2) [式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル基、エチル基等の低級アルキル基を表す。] で表される化合物は、次のようにして合成できる。

5 反応式 1 6



すなわち、一般式 (3 9) [式中、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル基、エチル基等の低級アルキル基を表す。] で表される化合物と、一般式 (7) [式中、 R^5 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (3 2-1) [式中、 X^2 、 R^5 、 m 及び R は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

さらに、この一般式 (3 2-1) で表される化合物と、一般式 (8) [式中、 R^6 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 B と同様な条件下反応させることにより、一般式 (3 2-2) [式中、 X^2 、 R^5 、 R^6 、 m 及び R は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

15 ここで、用いられる一般式 (3 9) で表される化合物の或るものは公知化合物 (例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1929年、51巻、1865頁等に記載の化合物。) であり、また、それ以外のものも文献記載の公知の方法を用いて容易に合成することができる。

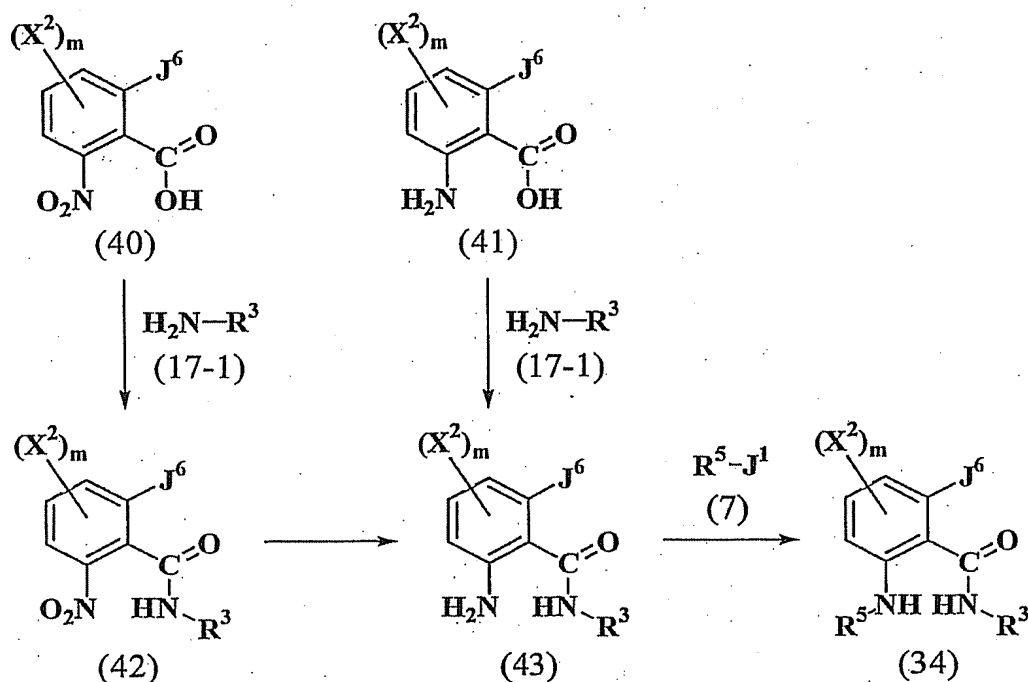
20 反応式 1 3 で用いられる一般式 (3 4) [式中、 X^2 、 R^3 、 R^5 、 m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物は、例えば下記の反応式 1 7 又は反応式 1 8 で表される方法等を用いて合成できる。

反応式 1 7

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

108



すなわち、一般式 (40) [式中、 X^2 、 m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (17) において R^2 が水素原子である一般式 (17-1) [式中、 R^3 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 II と同様な条件下反応させるか、或いは一般式 (40) で表される化合物を、塩化チオニル又はオキザリルクロライド等のクロル化剤を用いて、対応するカルボン酸クロライドした後に一般式 (17-1) で表される化合物と反応させることにより、一般式 (42) [式中、 X^2 、 R^3 、 m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

この一般式 (42) で表される化合物は、反応式 14 と同様な条件下反応させることにより、一般式 (43) [式中、 X^2 、 R^3 、 m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

さらに、この一般式 (43) で表される化合物と、一般式 (7) [式中、 R^5 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (34) で表される化合物を得ることができる。

また、一般式 (43) で表される化合物は、一般式 (41) [式中、 X^2 、 m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (17-1) で表される化合物とを、一般式 (40) で表される化合物の場合と同様に反応させることによっても得ることができる。

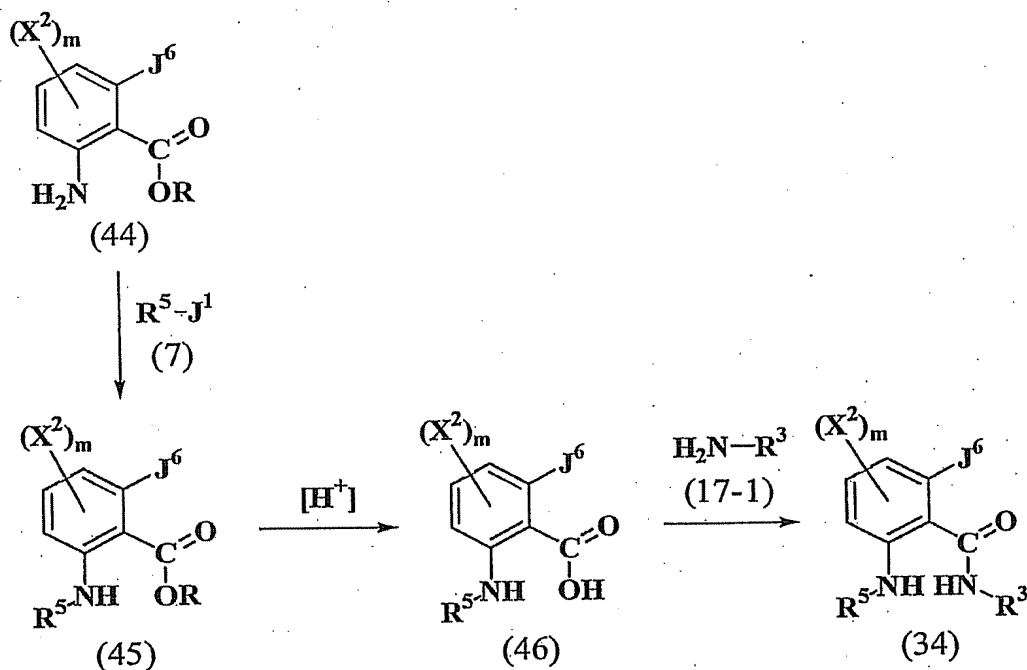
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

109

ここで、用いられる一般式(40)で表される化合物及び一般式(41)で表される化合物の或るものは公知化合物(例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[J. Org. Chem.] 1952年、17巻、167頁及び1954年、19巻、510頁等に記載の化合物。)であり、また、それ以外のものも文献記載の公知の方法を用いて容易に合成することができる。

反応式18



すなわち、一般式(44) [式中、 X^2 , m , J^6 及び R は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と、一般式(7) [式中、 R^5 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法Aと同様な条件下反応させることにより、一般式(45) [式中、 X^2 , R^5 , m , J^6 及び R は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を得ることができる。

この一般式(45)で表される化合物は、通常の安息香酸エステル類の加水分解反応条件下、容易に一般式(46) [式中、 X^2 , R^5 , m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。]で表される対応するカルボン酸誘導体に変換できる。

さらに、この一般式(46)で表される化合物と、一般式(17)において R^2 が水素原子である一般式(17-1) [式中、 R^3 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法Hと同様な条件下反応させるか、或いは一般式(44)で表される化合物を、塩化チオニル又はオキザリルクロライド等のクロル化剤を用いて、対応するカルボ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

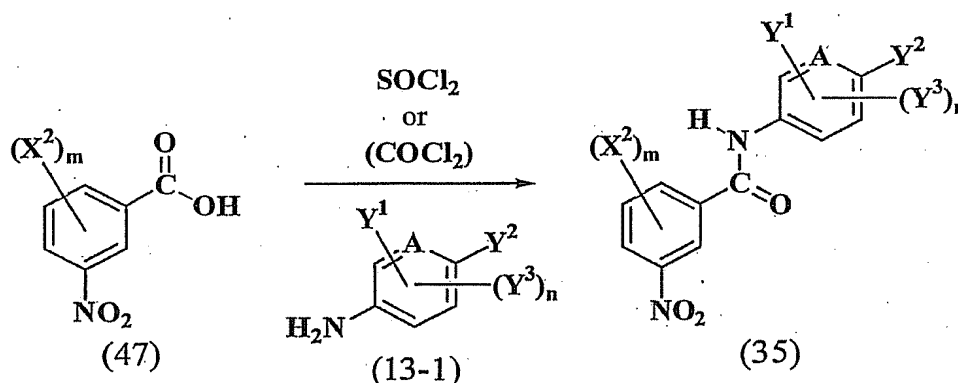
110

ン酸クロライドした後に一般式 (17-1) で表される化合物と反応させることにより、一般式 (34) で表される化合物を得ることができる。

ここで、用いられる一般式 (44) で表される化合物の或るものは公知化合物 (例えばテトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1993年、34巻、3083頁等に記載の化合物。) であり、また、それ以外のものも文献記載の公知の方法を用いて容易に合成することができる。

反応式 14 で用いられる一般式 (35) [式中、A、X²、Y¹、Y²、Y³、m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式 19



すなわち、公知の一般式 (47) [式中、X² 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (13) において R¹ が水素原子である一般式 (13-1) [式中、A、Y¹、Y²、Y³ 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 H と同様な条件下反応させるか、或いはを、一般式 (47) で表される化合物を、塩化チオニル又はオキザリルクロライド等のクロル化剤を用いて、対応するカルボン酸クロライドした後に、一般式 (13-1) で表される化合物と反応させることにより、一般式 (35) で表される化合物を得ることができる。

これらの各反応においては、反応終了後、通常の後処理を行なうことにより、製造法 A ~ S の原料化合物となる各々の製造中間体を得ることができる。

またこれらの方法により製造された各々の製造中間体は、単離・精製することなく、それぞれそのまま次工程の反応に用いることもできる。

本発明に包含される化合物としては、具体的に例えば、第 1 表 ~ 第 6 表に示す化合物が挙げられる。但し、第 1 表 ~ 第 6 表の化合物は例示のためのものであって、本発明は

WO 03/011028

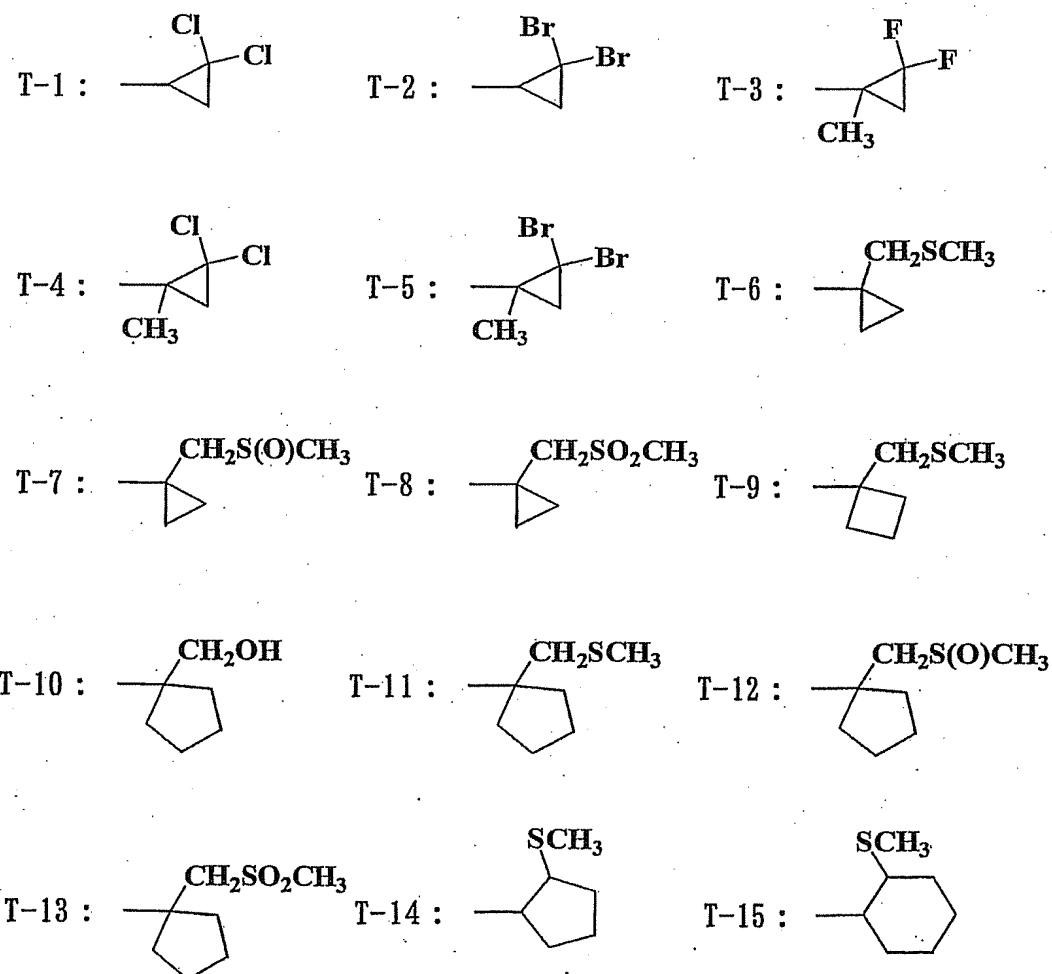
PCT/JP02/07833

111

これらのみに限定されるものではない。

尚、表中 Et との記載はエチルを表し、以下同様に n-Pr 及び Pr-n はノルマルプロピルを、i-Pr 及び Pr-i はイソプロピルを、c-Pr 及び Pr-c はシクロプロピルを、n-Bu 及び Bu-n はノルマルブチルを、s-Bu 及び Bu-s はセカンダリーブチルを、i-Bu 及び Bu-i はイソブチルを、t-Bu 及び Bu-t はターシャリーブチルを、c-Bu 及び Bu-c はシクロブチルを、n-Pen 及び Pen-n はノルマルペンチルを、c-Pen 及び Pen-c はシクロペンチルを、n-Hex 及び Hex-n はノルマルヘキシルを、c-Hex 及び Hex-c はシクロヘキシルを、Ph はフェニルを、Naph はナフチルをそれぞれ表し、

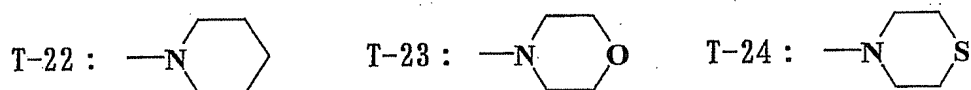
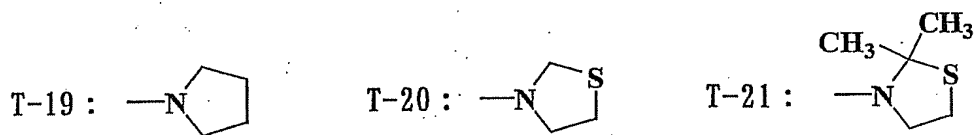
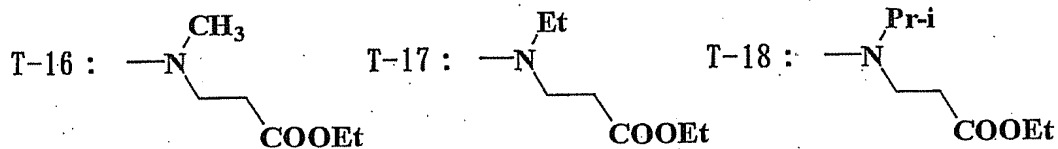
表中 T-1～T-24 は、それぞれ下記の構造を表し、



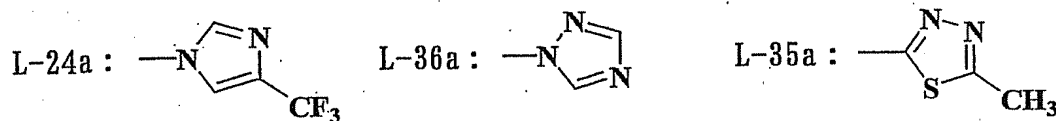
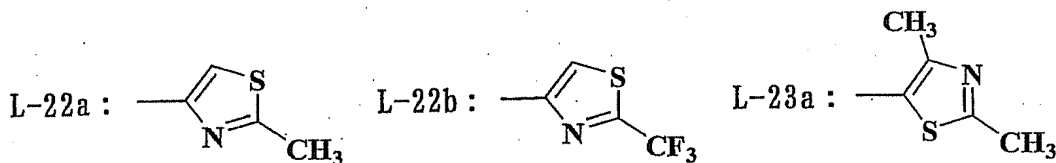
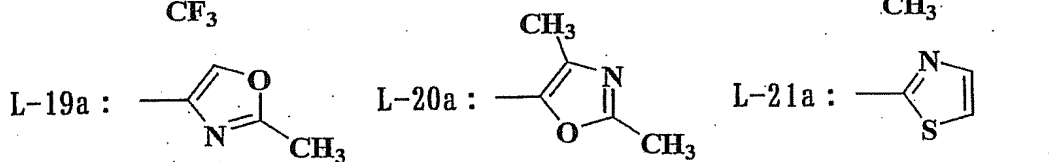
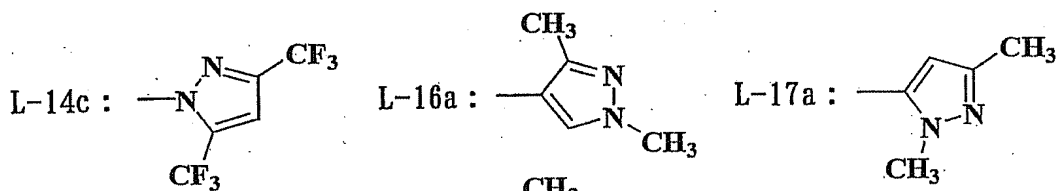
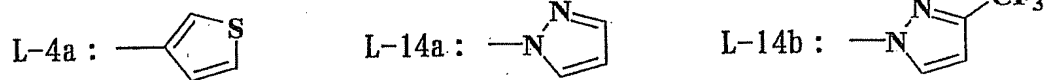
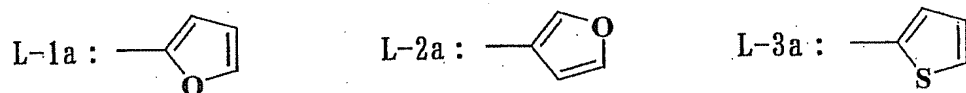
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

112



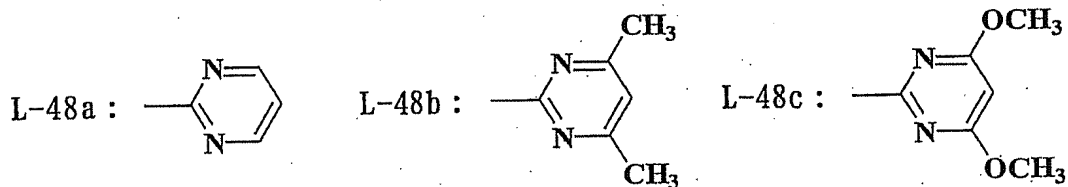
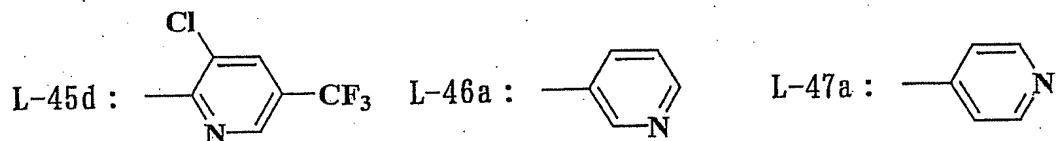
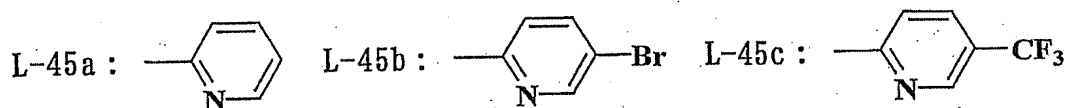
表中 L-1a~L-48c で表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、



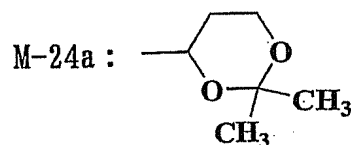
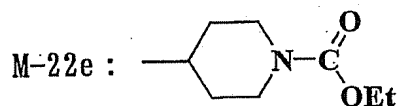
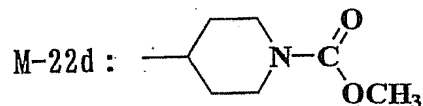
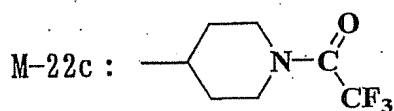
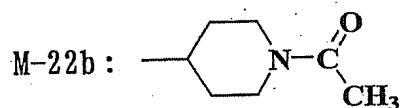
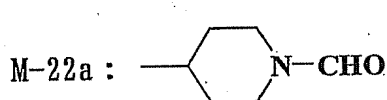
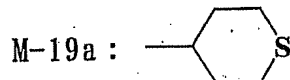
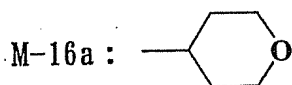
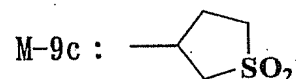
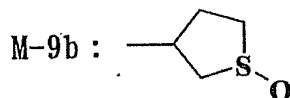
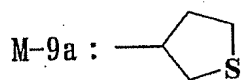
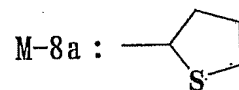
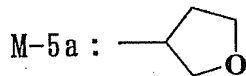
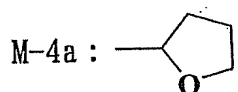
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

113



さらに、表中 M-4a~M-24a で表される脂肪族複素環は、それぞれ下記の構造を表す。



また、表中、置換基 $(X^2)_m$ 、 $(Y^3)_n$ 及び置換基 $(R^4)_p$ の置換位置を表す番号は、それぞ

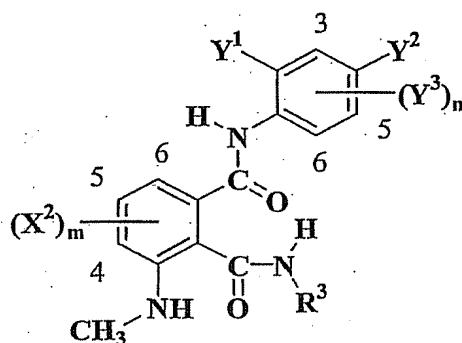
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

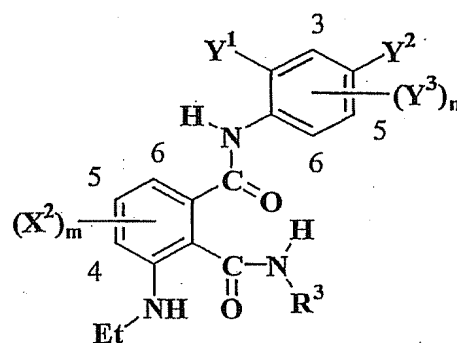
114

れ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものである。

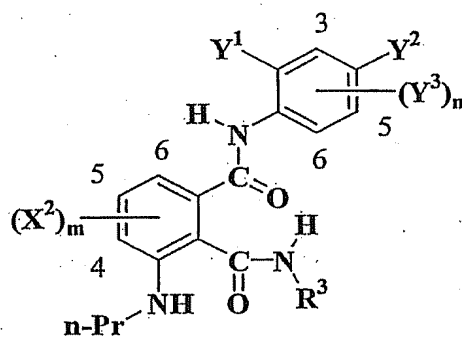
第1表



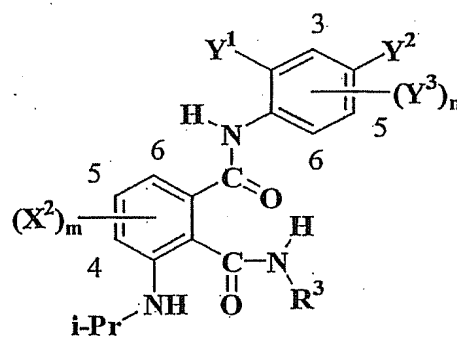
[1] - 1



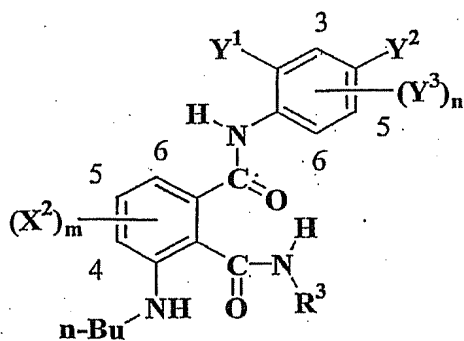
[1] - 2



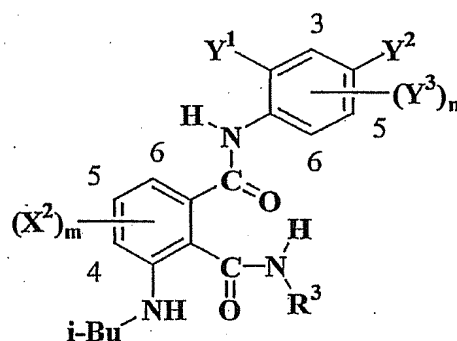
[1] - 3



[1] - 4



[1] - 5

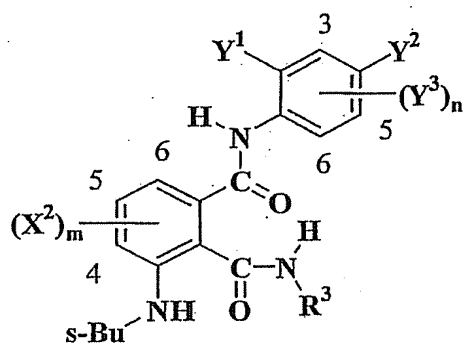


[1] - 6

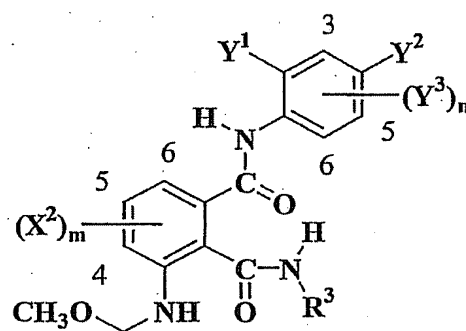
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

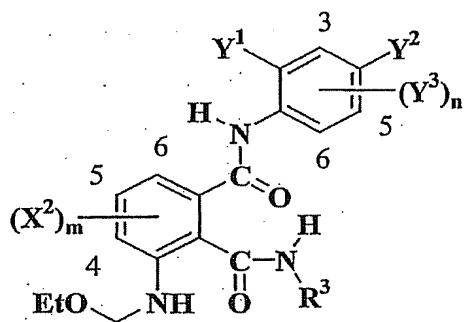
115



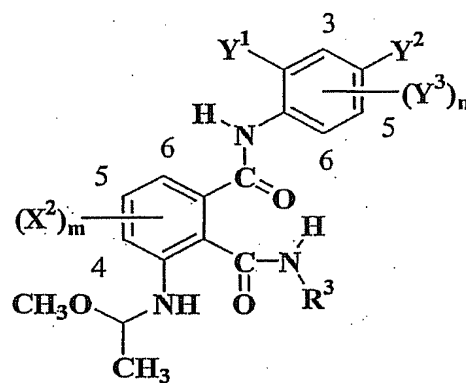
[1]-7



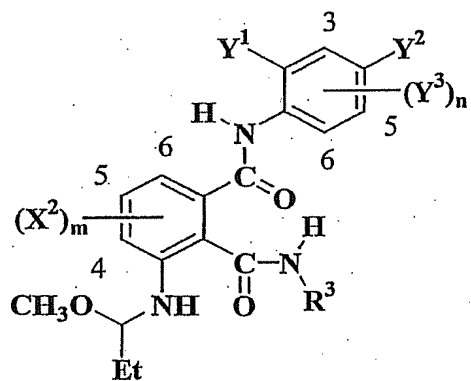
[1]-8



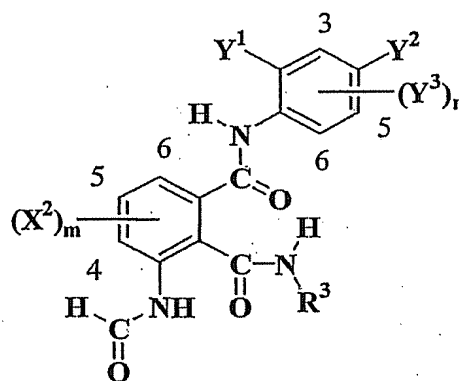
[1]-9



[1]-10



[1]-11

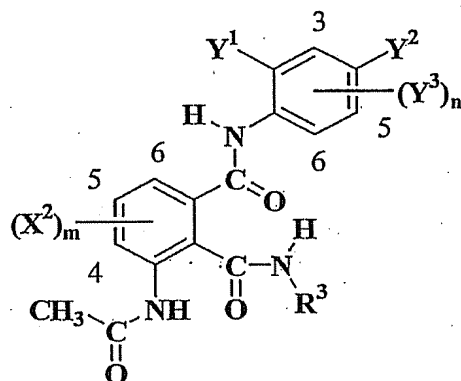


[1]-12

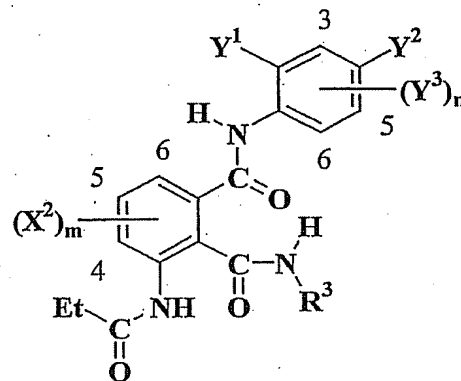
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

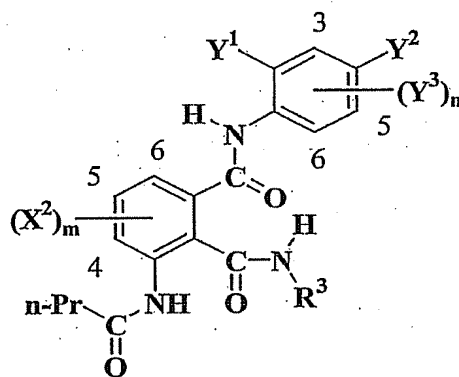
116



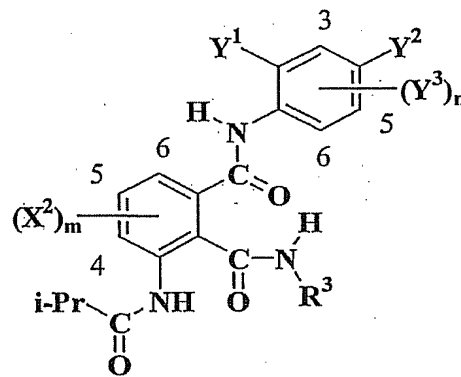
[1] - 13



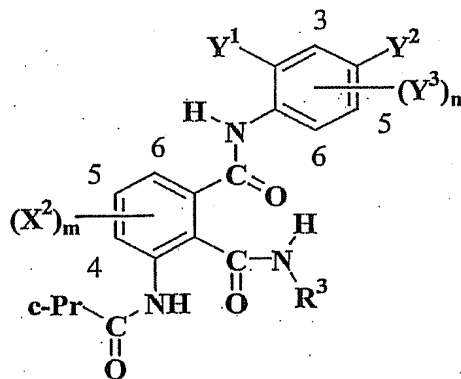
[1] - 14



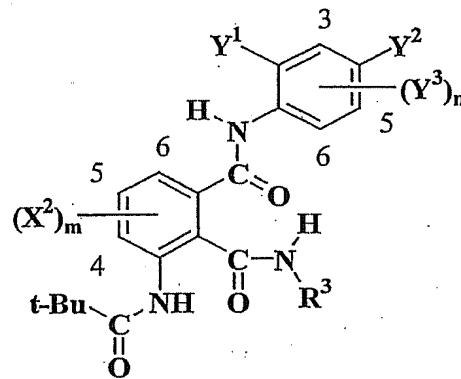
[1] - 15



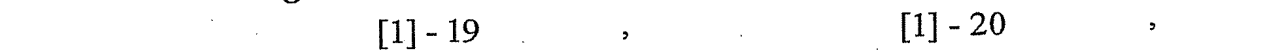
[1] - 16



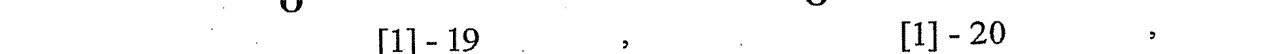
[1] - 17



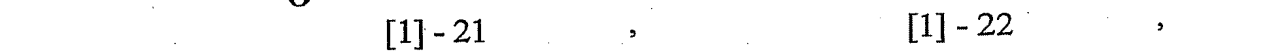
[1] - 18



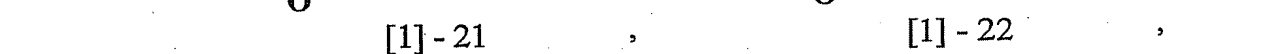
[1] - 19



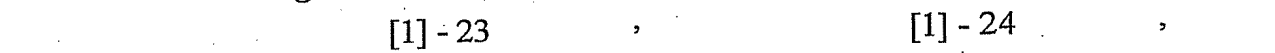
[1] - 20



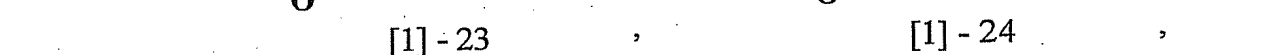
[1] - 21



[1] - 22



[1] - 23

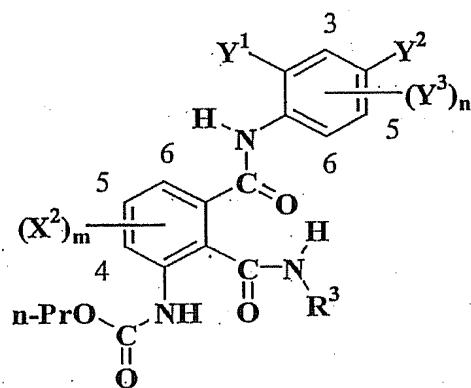


[1] - 24

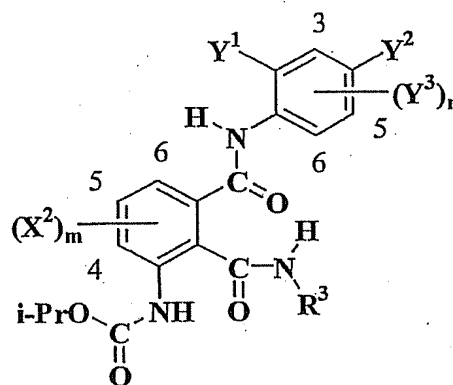
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

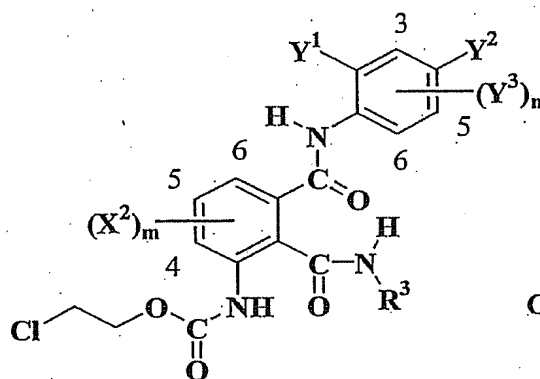
118



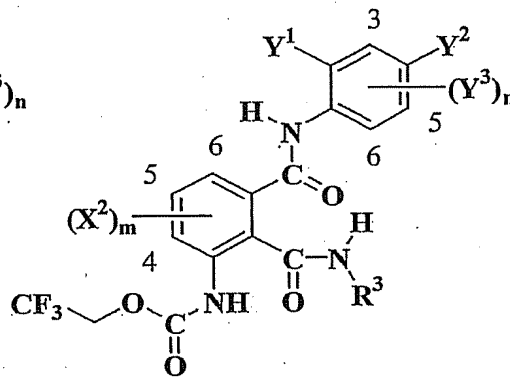
[1] - 25



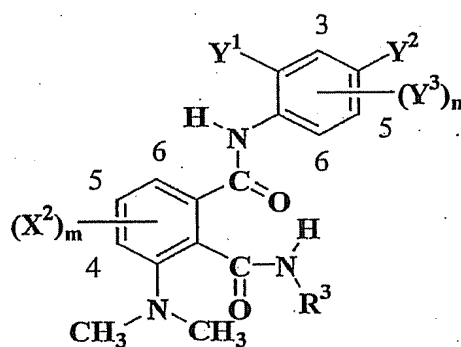
[1] - 26



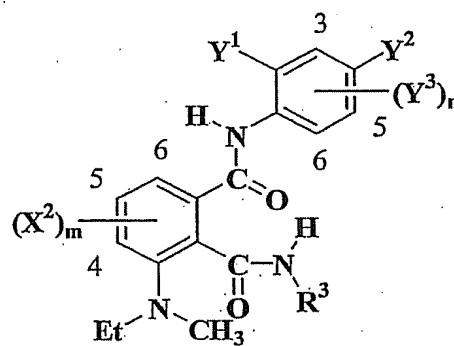
[1] - 27



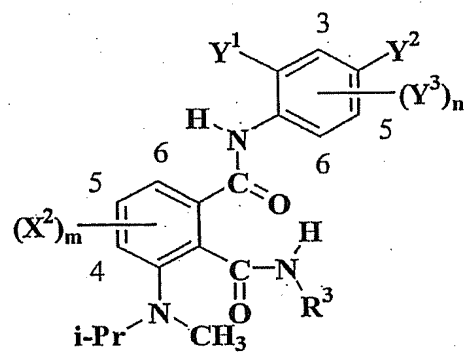
[1] - 28



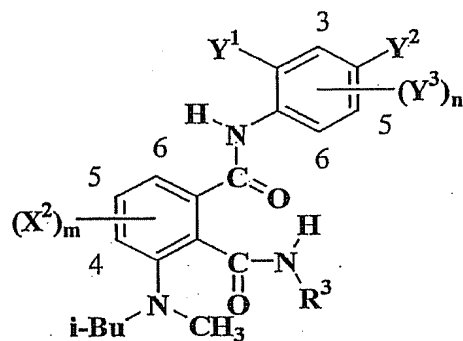
[1] - 29



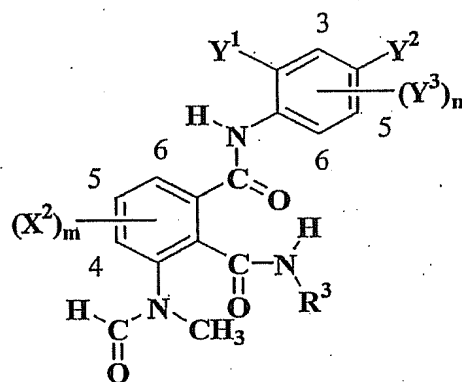
[1] - 30



[1] - 32



[1] - 34

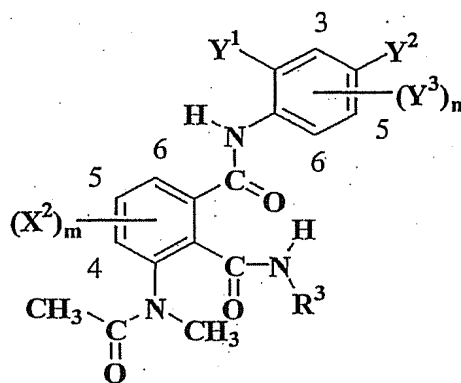


[1] - 36

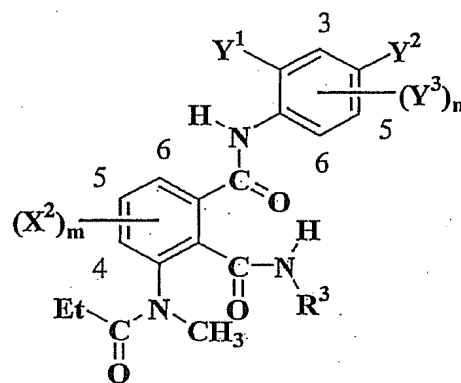
WO-03/011028

PCT/JP02/07833

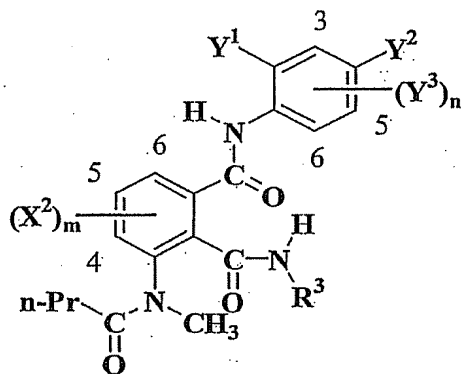
120



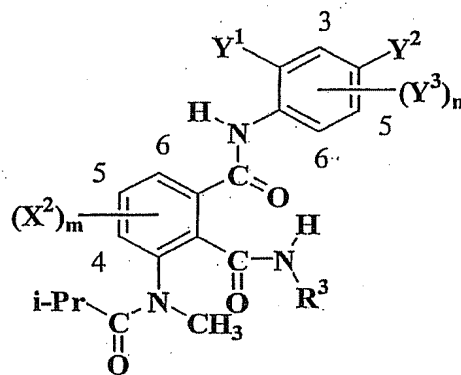
[1] - 37



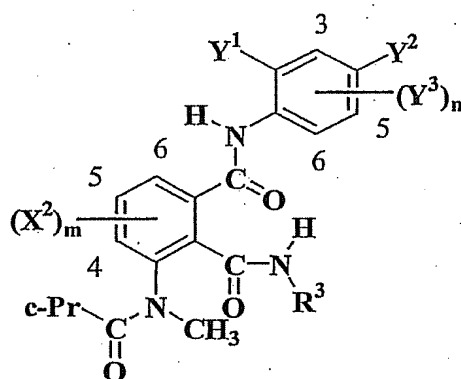
[1] - 38



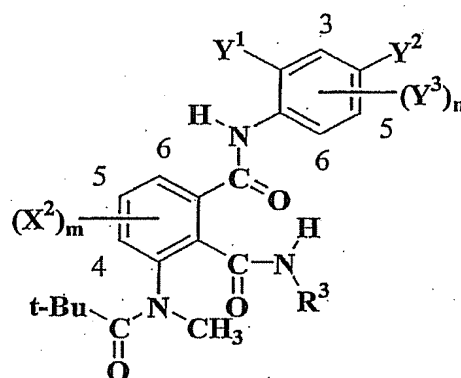
[1] - 39



[1] - 40



[1] - 41

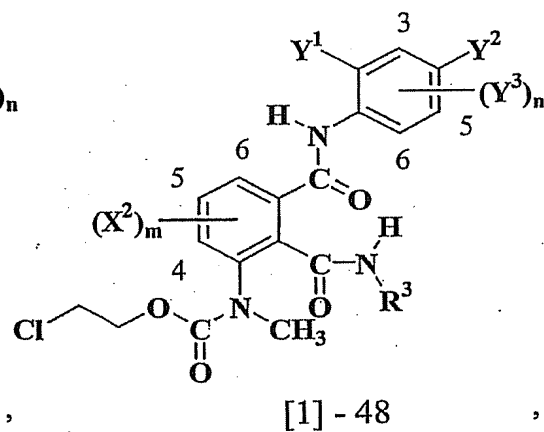
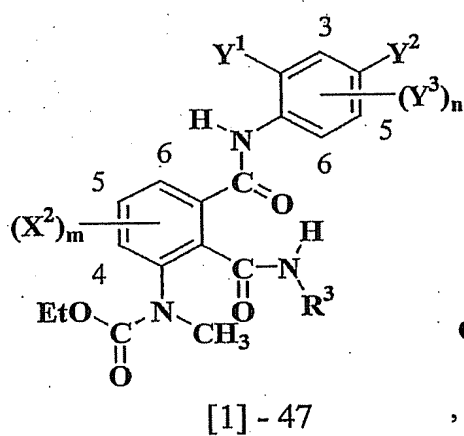
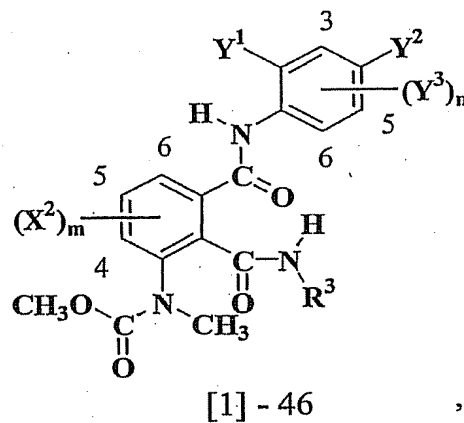
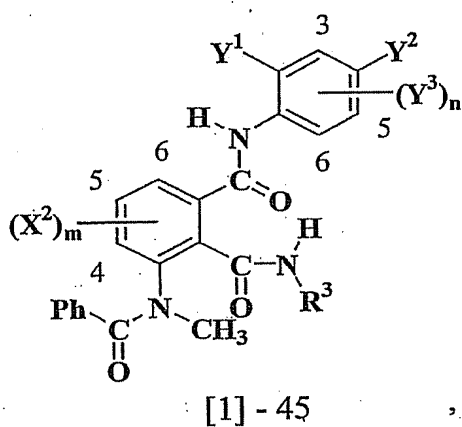
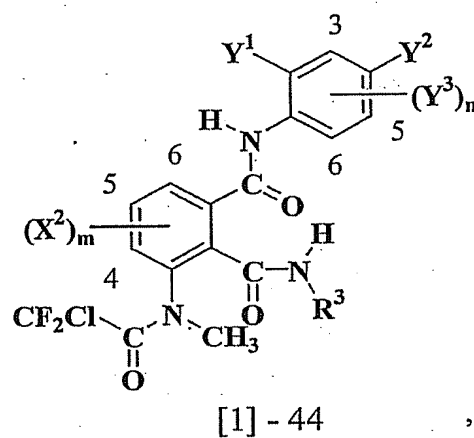
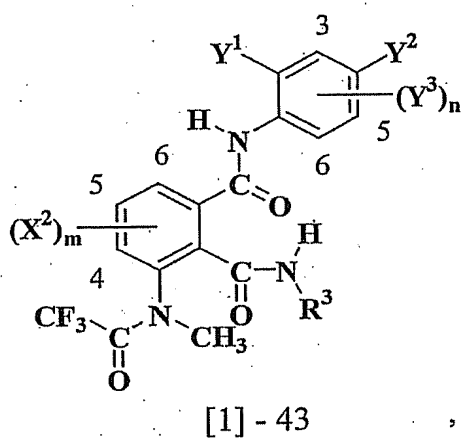


[1] - 42

WO 03/011028

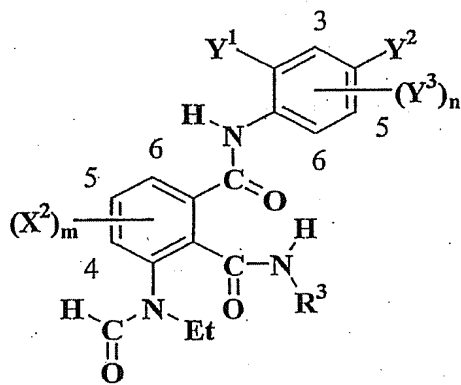
PCT/JP02/07833

121

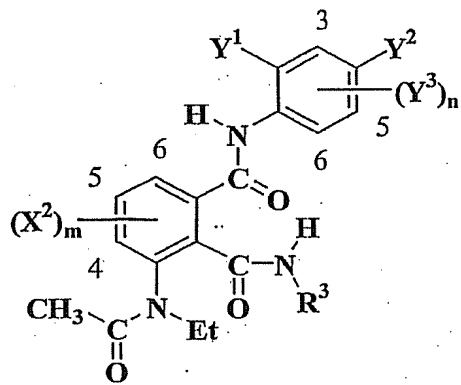


PCT/JP02/07833

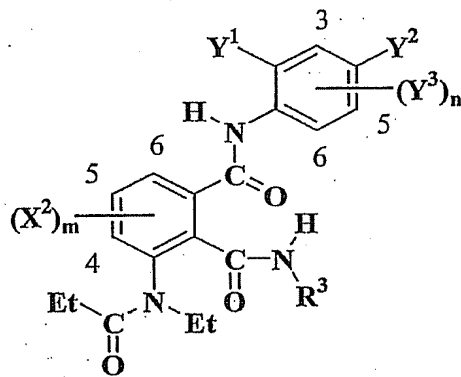
122



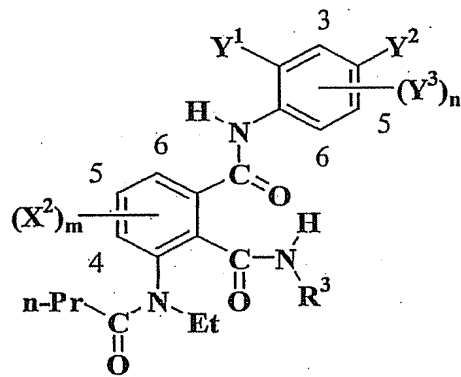
[1] - 49



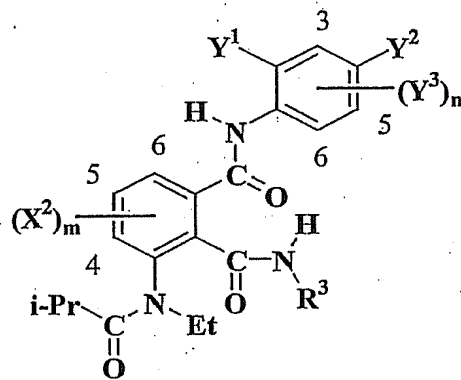
[1] - 50



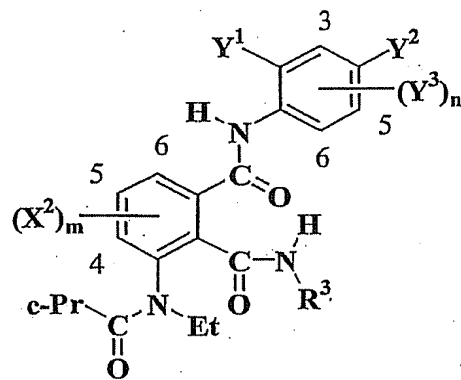
[1] - 51



[1] - 52



[1] - 53

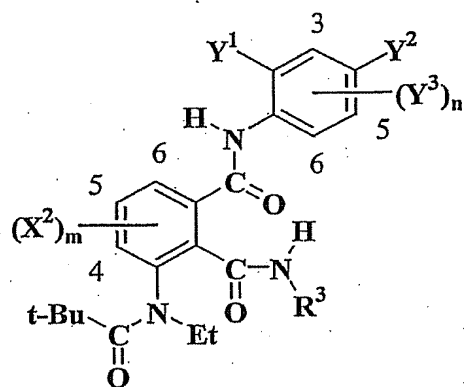


[1] - 54

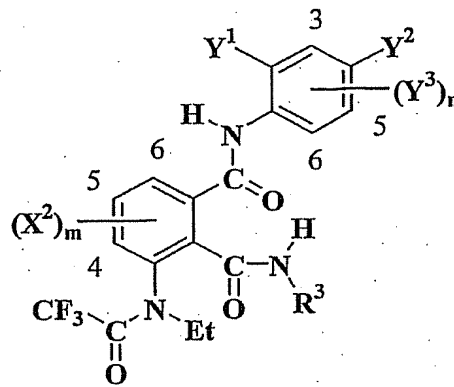
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

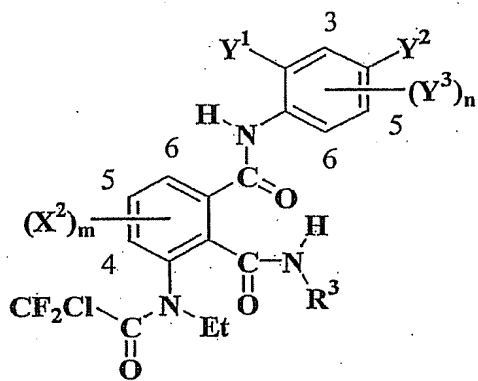
123



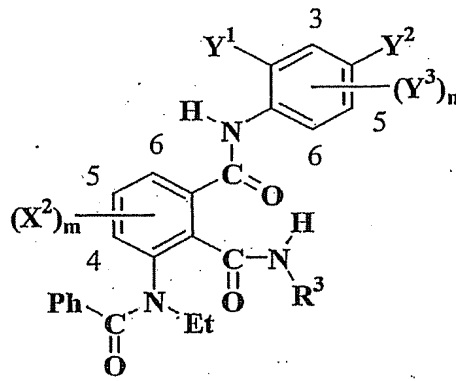
[1] - 55



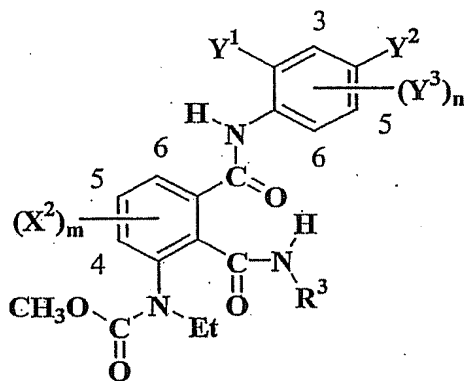
[1] - 56



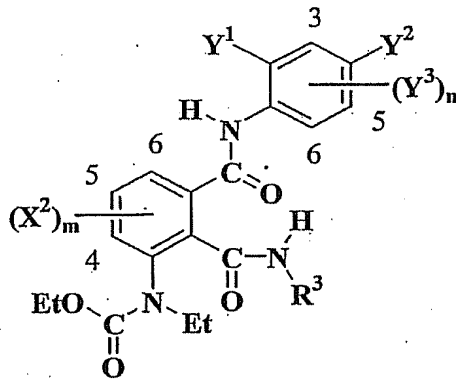
[1] - 57



[1] - 58



[1] - 59

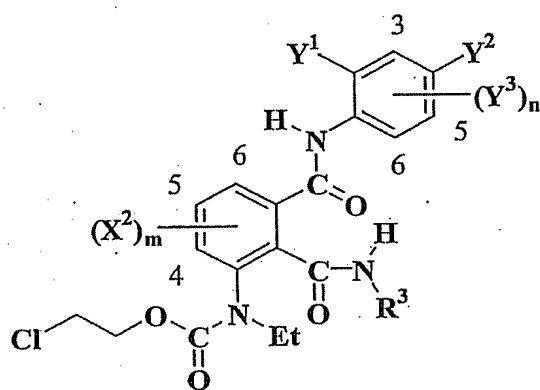


[1] - 60

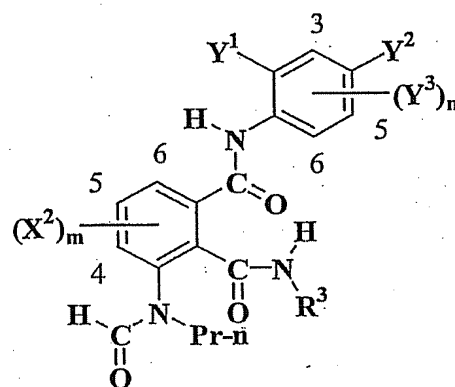
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

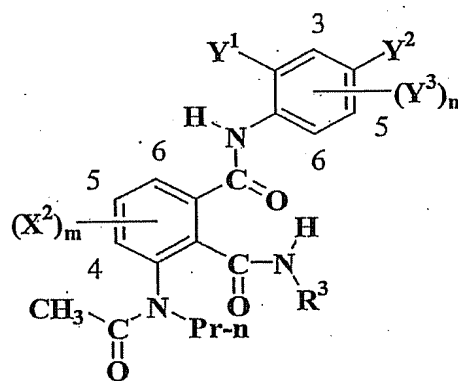
124



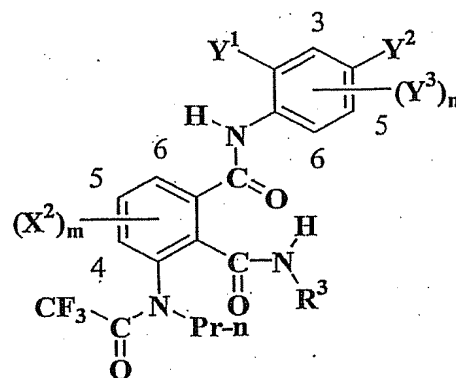
[1] - 61



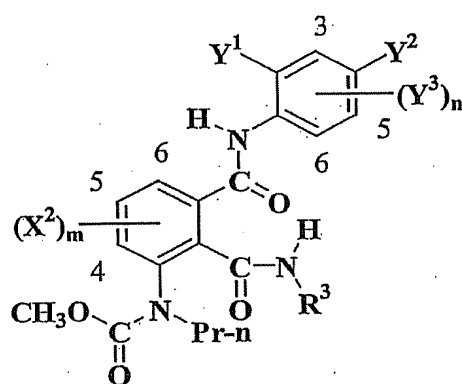
[1] - 62



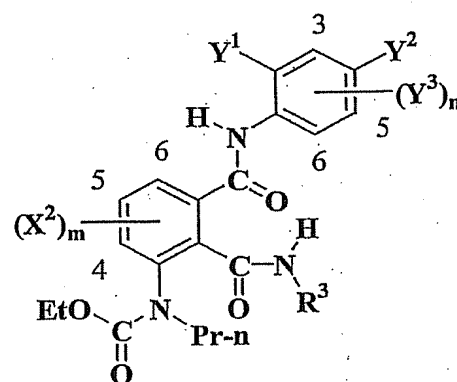
[1] - 63



[1] - 64



[1] - 65

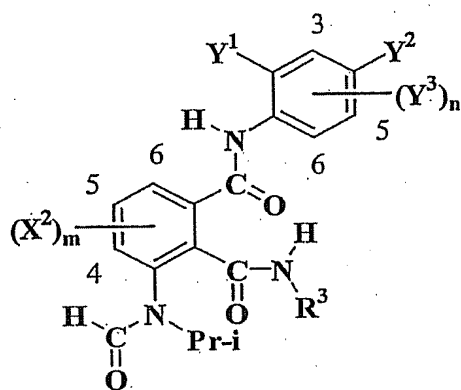


[1] - 66

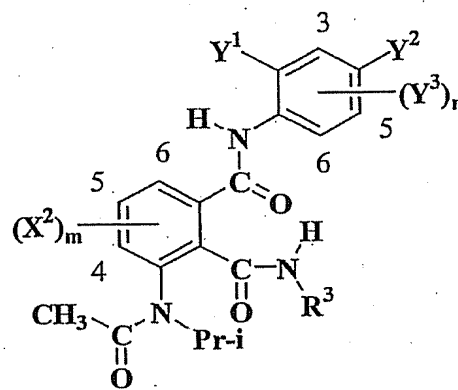
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

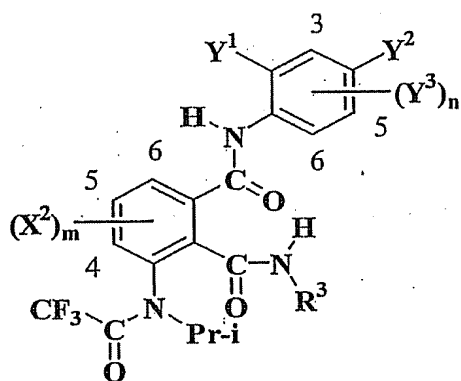
125



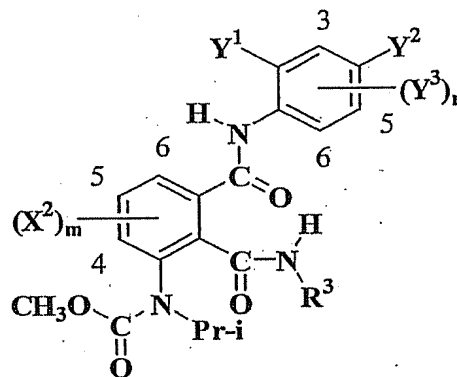
[1] - 67



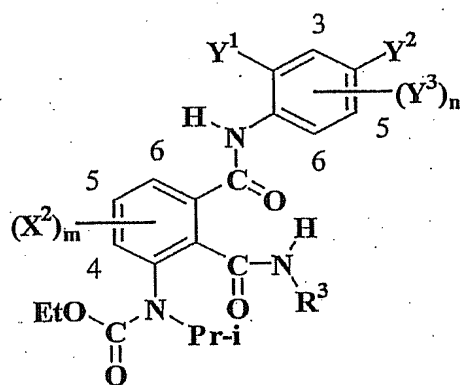
[1] - 68



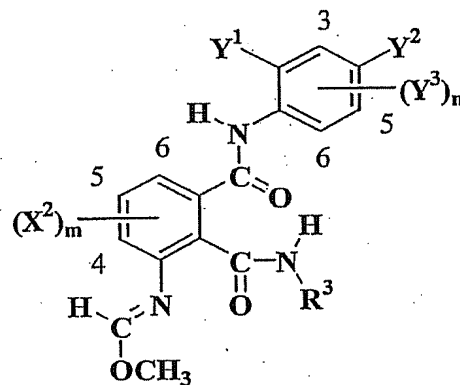
[1] - 69



[1] - 70



[1] - 71

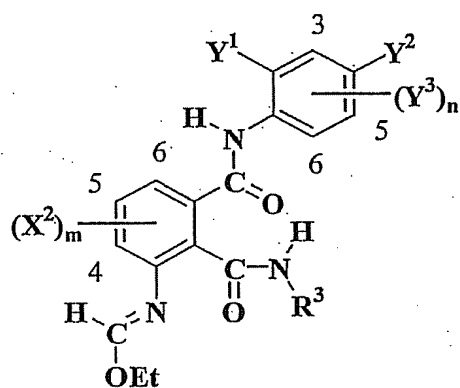


[1] - 72

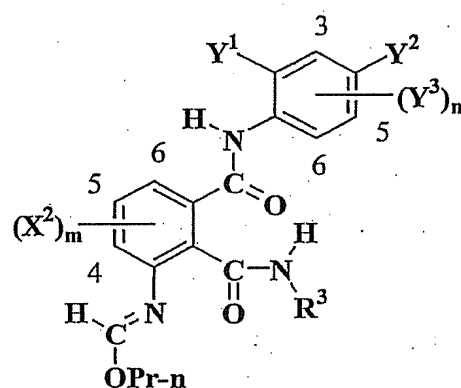
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

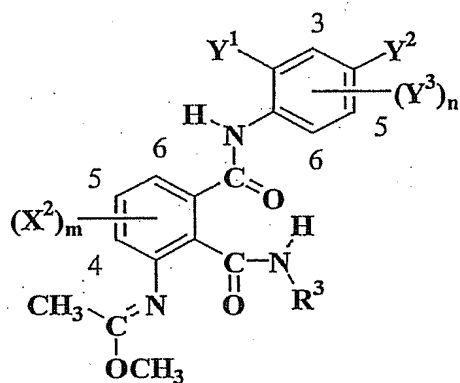
126



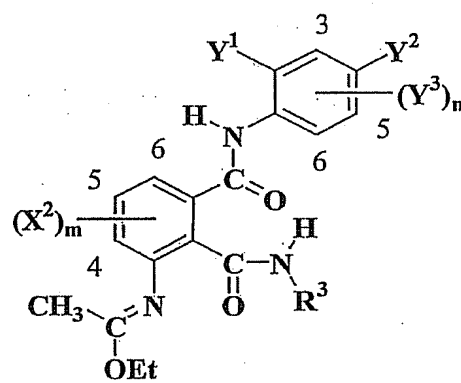
[1] - 73



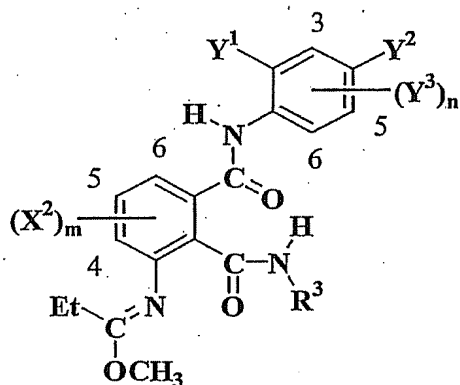
[1] - 74



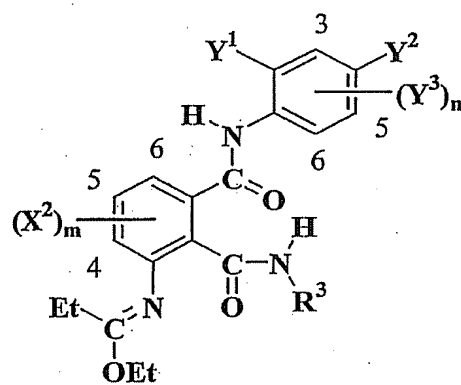
[1] - 75



[1] - 76



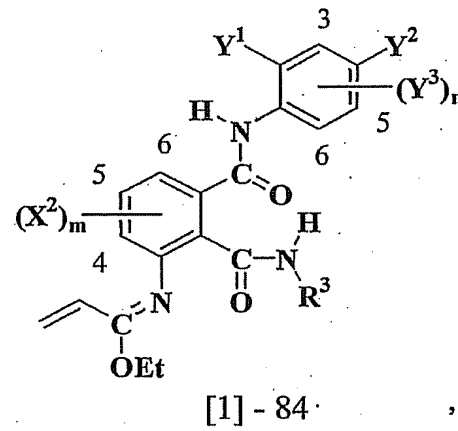
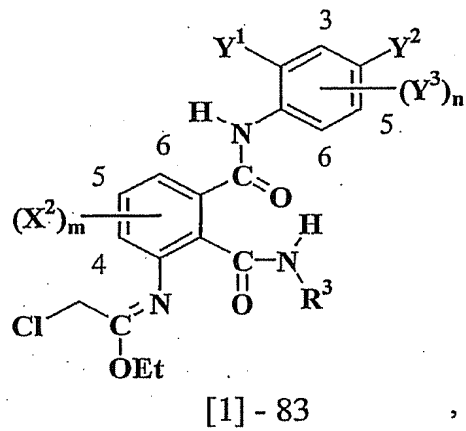
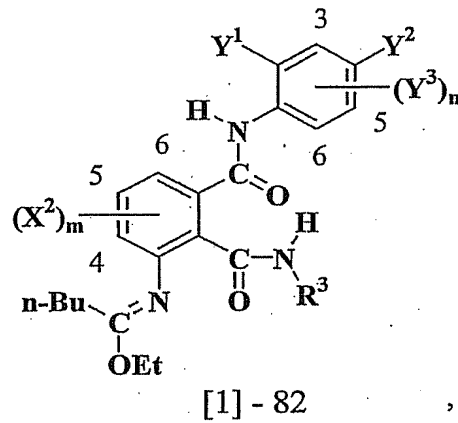
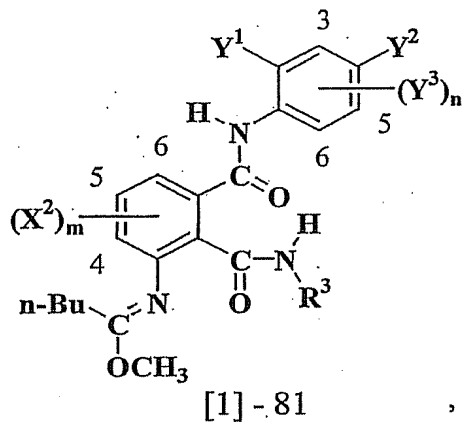
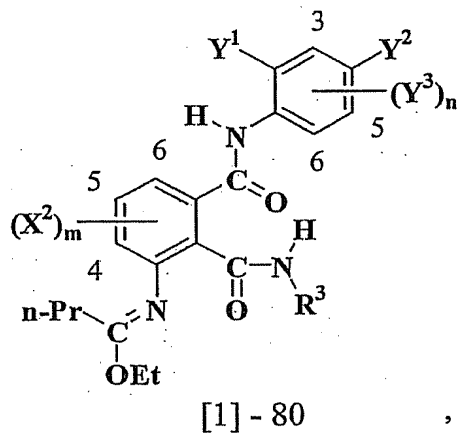
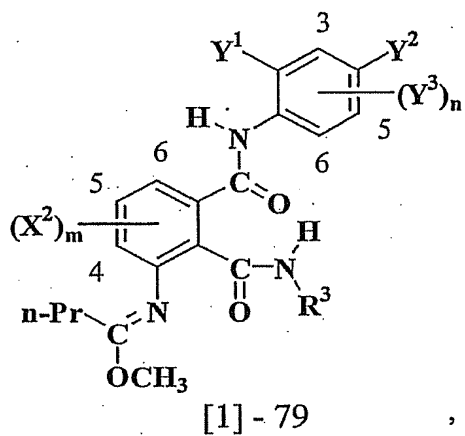
[1] - 77



[1] - 78

PCT/JP02/07833

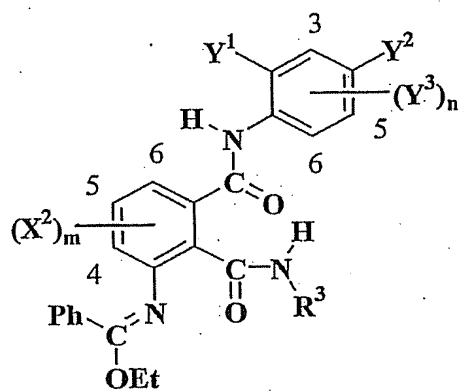
127



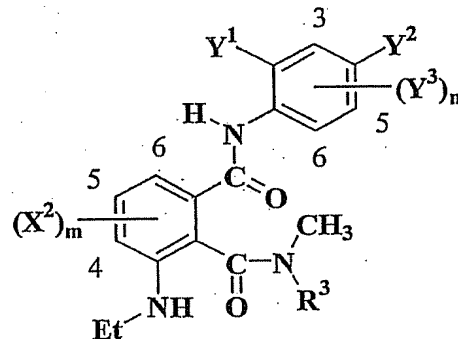
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

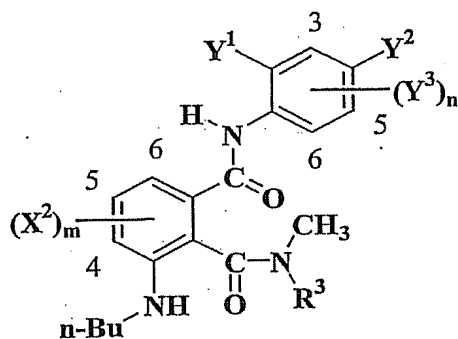
128



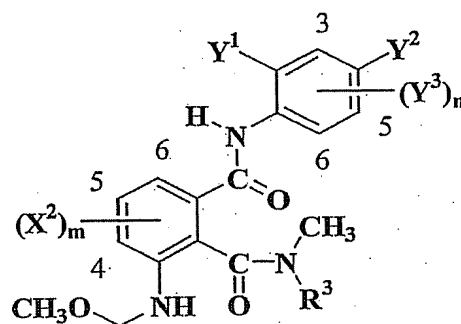
[1] - 85



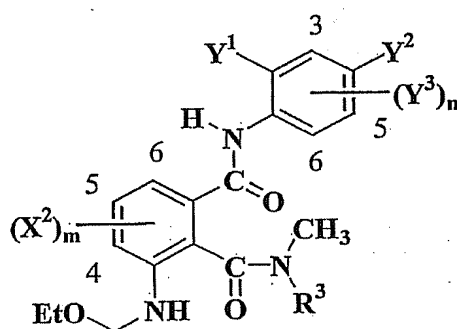
[1] - 86



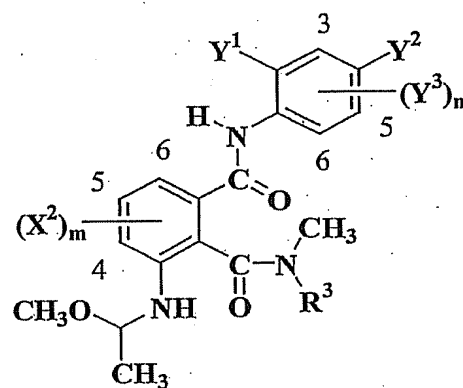
[1] - 87



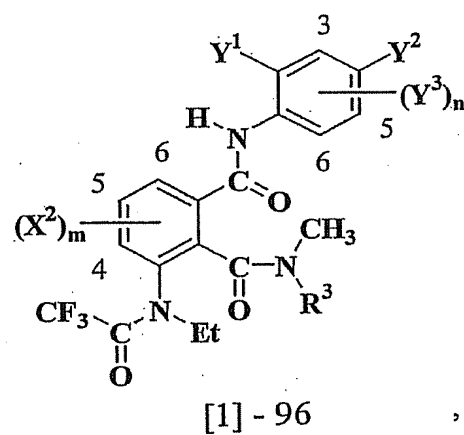
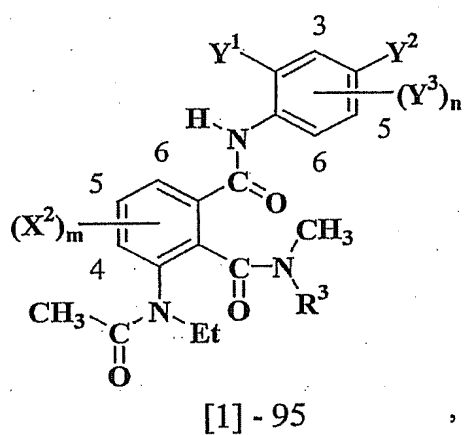
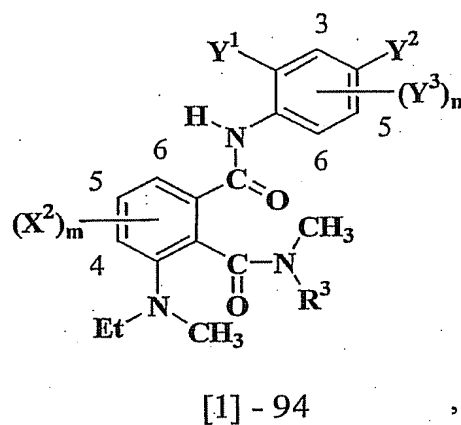
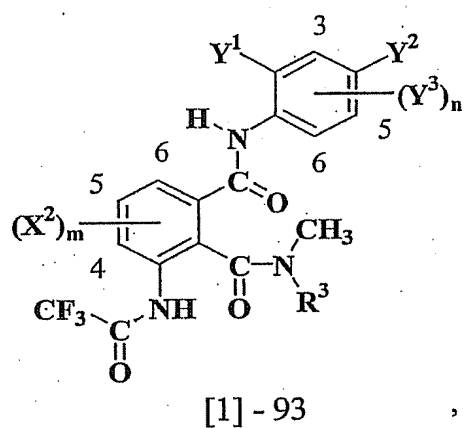
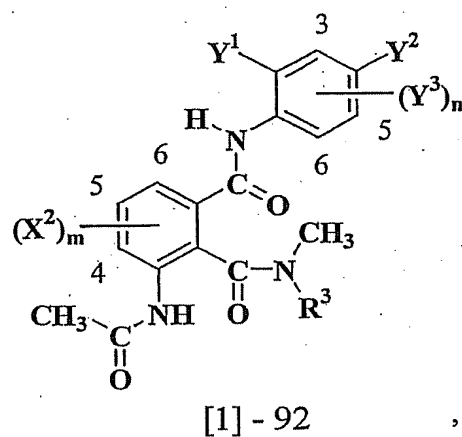
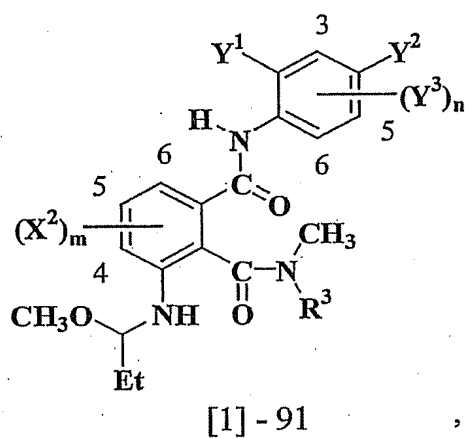
[1] - 88



[1] - 89



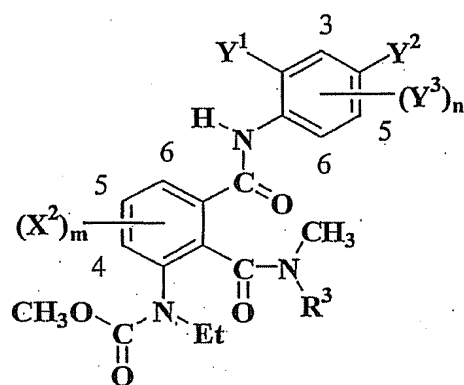
[1] - 90



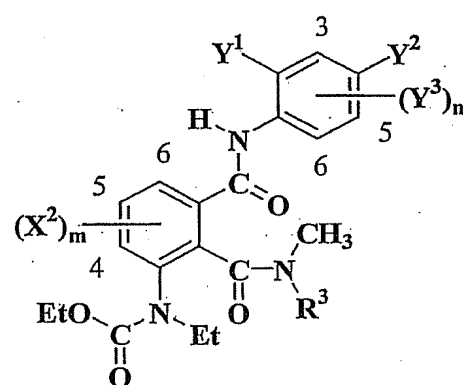
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

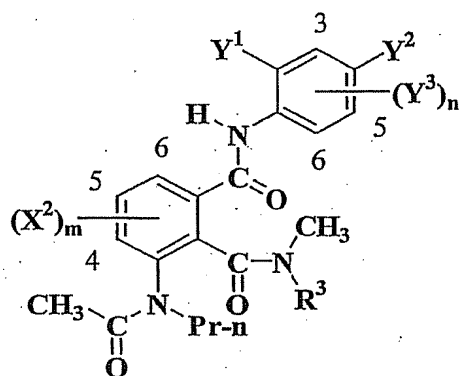
130



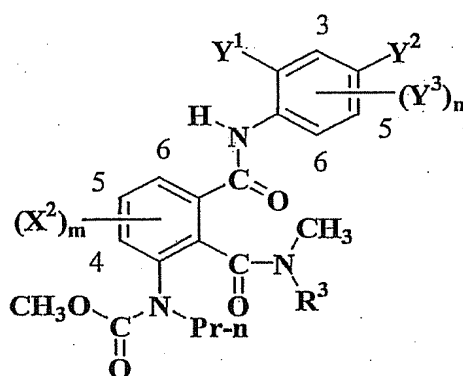
[1] - 97



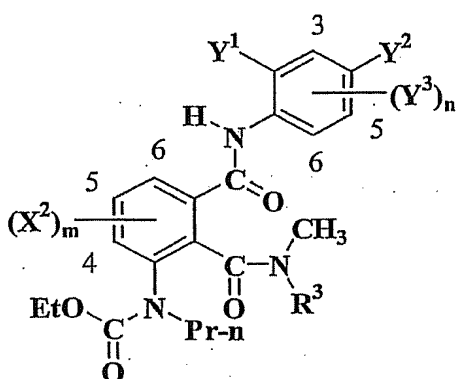
[1] - 98



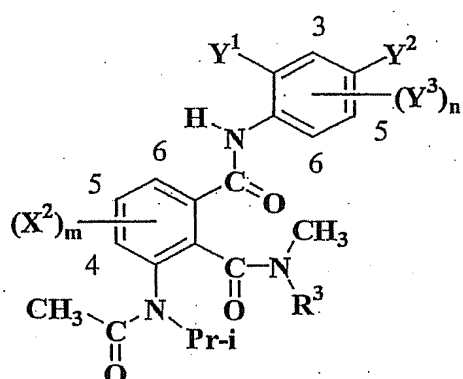
[1] - 99



[1] - 100



[1] - 101

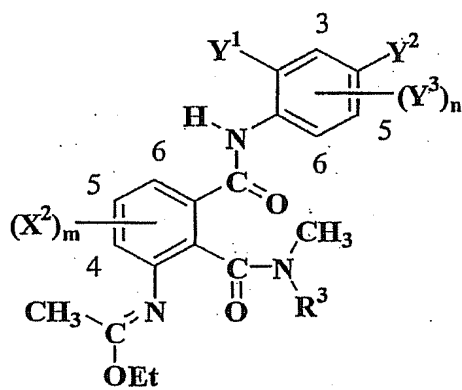


[1] - 102

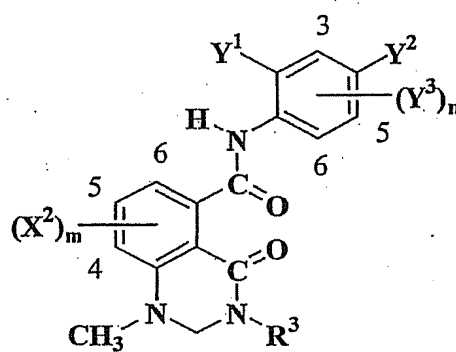
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

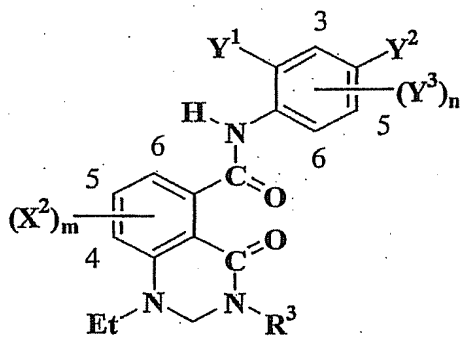
131



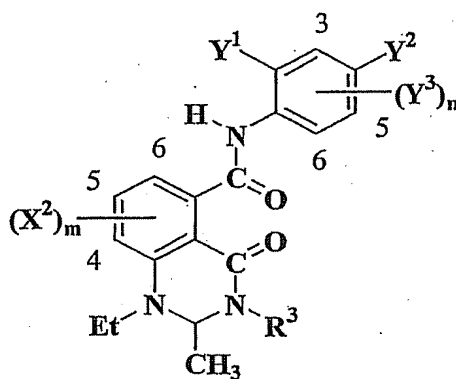
[1] - 103



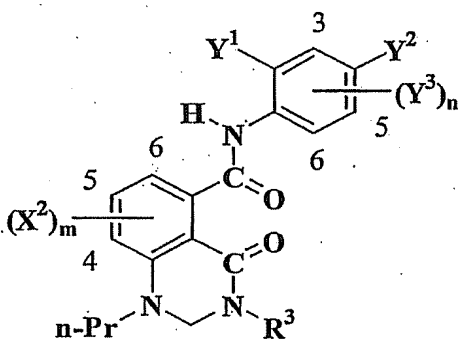
[1] - 104



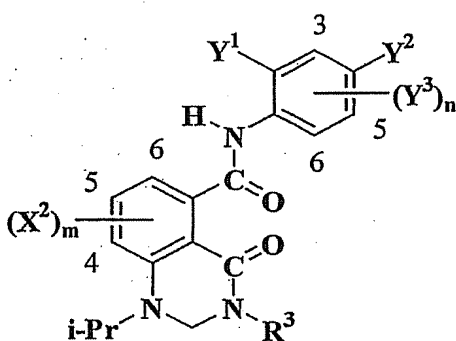
[1] - 105



[1] - 106



[1] - 107

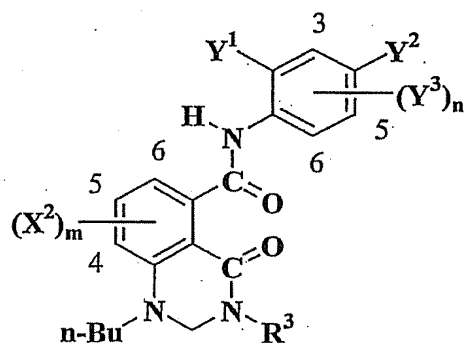


[1] - 108

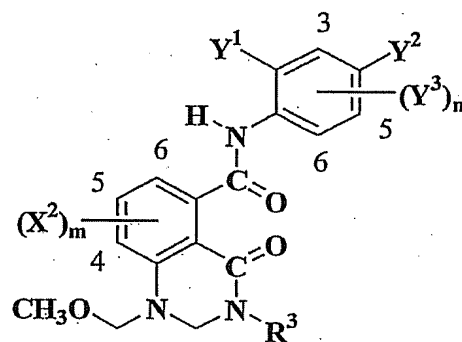
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

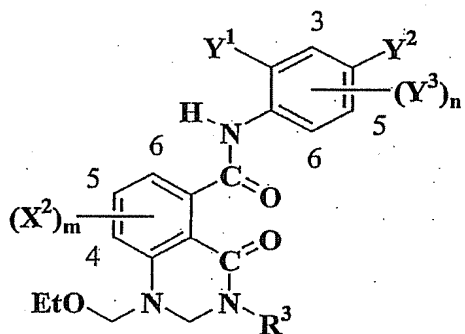
132



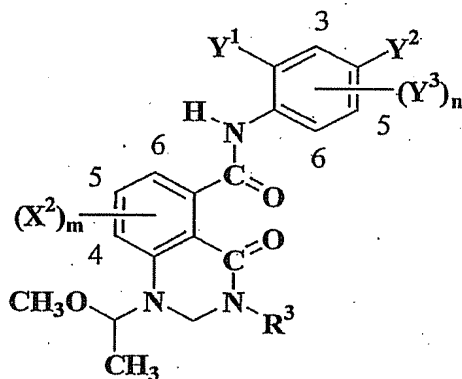
[1] - 109



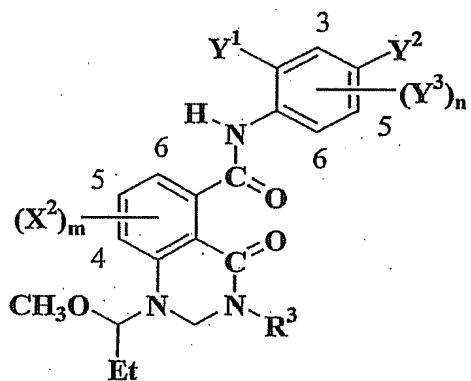
[1] - 110



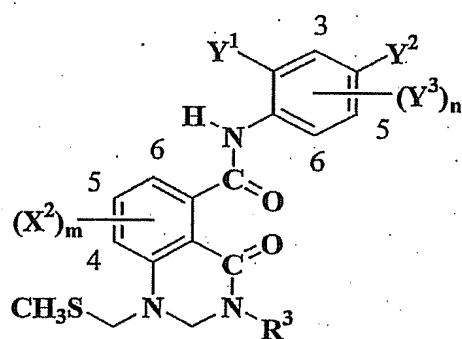
[1] - 111



[1] - 112



[1] - 113

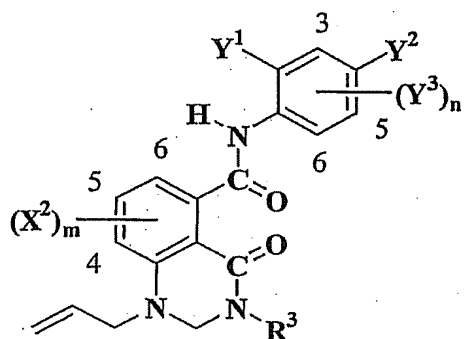


[1] - 114

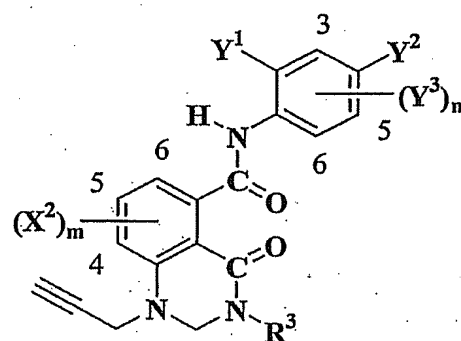
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

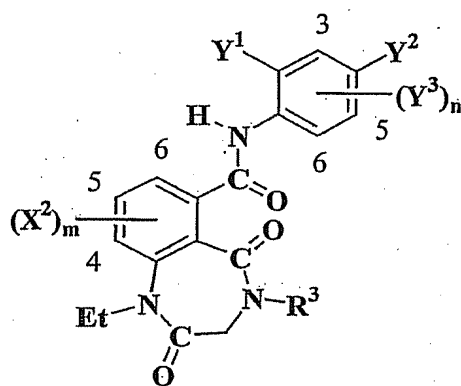
133



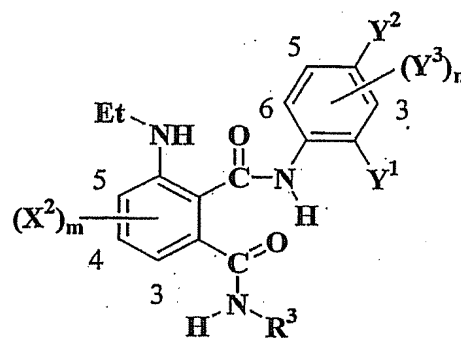
[1] - 115



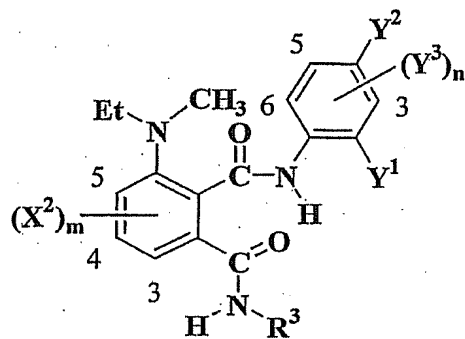
[1] - 116



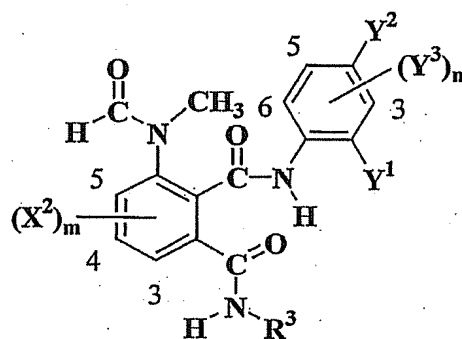
[1] - 117



[1] - 118



[1] - 119

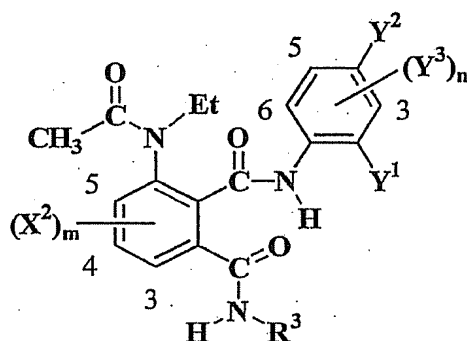


[1] - 120

WO 03/011028

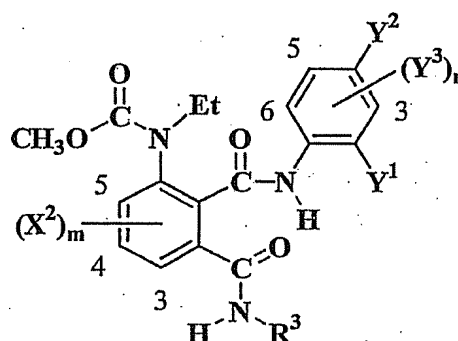
PCT/JP02/07833

134



[1] - 121

または



[1] - 122

	(X ²) _m	R ³	Y ¹	Y ²	(Y ³) _n
5	H	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
10	H	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
15	H	n-Pr	F	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	n-Pr	Cl	CF (CF ₃) ₂	H
	H	n-Pr	Cl	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	n-Pr	Br	CF (CF ₃) ₂	H
	H	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	H	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
25	H	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	n-Pr	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	n-Pr	Et	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	n-Pr	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	H	H
30	H	i-Pr	H	H	3-F
	H	i-Pr	H	H	3-Cl
	H	i-Pr	H	H	3-Br
	H	i-Pr	H	H	3-CH ₃
	H	i-Pr	H	H	3-CF ₃

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

135

	H	i-Pr	H	H	3-OCH ₃
	H	i-Pr	H	H	3-OPr-i
	H	i-Pr	H	H	3-OCHF ₂
	H	i-Pr	H	H	3-SCH ₃
5	H	i-Pr	H	H	3-SCF ₃
	H	i-Pr	H	H	3-S (O) CF ₃
	H	i-Pr	H	H	3- (L-19a)
	H	i-Pr	H	H	3- (L-22b)
	H	i-Pr	H	H	3,5-Cl ₂
10	H	i-Pr	H	H	3-CF ₃ -5-OCH ₃
	H	i-Pr	H	F	H
	H	i-Pr	H	F	3-F
	H	i-Pr	H	F	3-Cl
	H	i-Pr	H	Cl	H
15	H	i-Pr	H	Cl	3-Cl
	H	i-Pr	H	Cl	3-CF ₃
	H	i-Pr	H	Cl	3-O (L-45d)
	H	i-Pr	H	Br	H
	H	i-Pr	H	Br	3-CH ₃
20	H	i-Pr	H	I	H
	H	i-Pr	H	CH ₃	H
	H	i-Pr	H	Et	H
	H	i-Pr	H	Pr-n	H
	H	i-Pr	H	Pr-i	H
25	H	i-Pr	H	Bu-n	H
	H	i-Pr	H	Bu-t	H
	H	i-Pr	H	CF ₃	H
	H	i-Pr	H	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	CF ₂ CF ₃	3-Cl
30	H	i-Pr	H	CF ₂ CF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	H	CF (CF ₃) ₂	3-F
	H	i-Pr	H	CF (CF ₃) ₂	3-Cl
35	H	i-Pr	H	CF (CF ₃) ₂	3-SCH ₃
	H	i-Pr	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	H	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	H	T-1	H
40	H	i-Pr	H	T-2	H
	H	i-Pr	H	T-3	H
	H	i-Pr	H	T-4	H
	H	i-Pr	H	T-5	H
	H	i-Pr	H	CH ₂ ON=C (Pr-c) Ph-4-Cl	H
45	H	i-Pr	H	OCH ₃	H
	H	i-Pr	H	OCHF ₂	H
	H	i-Pr	H	OCHF ₂	3-F

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

136

5	H	i-Pr	H	OCHF ₂	3-Cl
	H	i-Pr	H	OCHF ₂	3-CF ₃
	H	i-Pr	H	OCHF ₂	3-OCH ₃
	H	i-Pr	H	OCHF ₂	3-OCHF ₂
	H	i-Pr	H	OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	H	OCF ₃	H
	H	i-Pr	H	OCF ₂ CHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	H	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
10	H	i-Pr	H	OCF ₂ CHFOCF ₃	3-Cl
	H	i-Pr	H	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	OCH(CH ₃) Ph	H
	H	i-Pr	H	O (Ph-4-NO ₂)	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	H	O (L-45d)	3, 5-Cl ₂
15	H	i-Pr	H	SCHF ₂	H
	H	i-Pr	H	SCF ₃	H
	H	i-Pr	H	SCF ₂ Br	H
	H	i-Pr	H	SCH ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	SCF ₂ CHF ₂	H
20	H	i-Pr	H	SCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	i-Pr	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	SCF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	S (O) CF ₃	H
25	H	i-Pr	H	S (O) CF ₂ Br	H
	H	i-Pr	H	SO ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H	SO ₂ N (Et) ₂	H
	H	i-Pr	H	NO ₂	H
	H	i-Pr	H	C (O) CH ₃	H
30	H	i-Pr	H	C (CH ₃) =NOCH ₃	H
	H	i-Pr	H	C (CH ₃) =NOCH ₂ CH=CH ₂	H
	H	i-Pr	H	CN	H
	H	i-Pr	H	CH=CCl ₂	H
	H	i-Pr	H	CH=CBr ₂	H
35	H	i-Pr	H	CH=C (Cl) CF ₃	H
	H	i-Pr	H	Ph	H
	H	i-Pr	H	L-14c	H
	H	i-Pr	H	L-22b	H
	H	i-Pr	H	L-24a	H
40	H	i-Pr	H	L-36a	H
	H	i-Pr	H	3-OCH ₂ O-4	
	H	i-Pr	H	3-OCF ₂ O-4	
	H	i-Pr	H	3-OCF ₂ CF ₂ -4	
	H	i-Pr	H	3-OCHF ₂ CF ₂ O-4	
	H	i-Pr	H	3-OCF ₂ CHFO-4	
45	H	i-Pr	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
	H	i-Pr	H	3-OCF ₂ OCF ₂ -4	
	H	i-Pr	H	3-OC (CF ₂ CF ₃) =N-4	

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

137

	H	i-Pr	H	3-OC (CF ₂ CF ₂ CF ₃) =N-4	
	H	i-Pr	H	3-N=C (CF ₃) O-4	
	H	i-Pr	H	3-N=C (CF ₂ CF ₃) O-4	
	H	i-Pr	H	3-N=C (CF ₂ CF ₂ CF ₃) O-4	
5	H	i-Pr	H	3-N=C (Ph-4-CF ₃) O-4	
	H	i-Pr	H	3-SC (Pr-i) =N-4	
	H	i-Pr	H	3-N=C (CF ₃) NH-4	
	H	i-Pr	H	3-N=C (CF ₃) N (CH ₃) -4	
10	H	i-Pr	F	H	H
	H	i-Pr	F	H	5-F
	H	i-Pr	F	F	H
	H	i-Pr	F	F	3-F
	H	i-Pr	F	F	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	F	F	3, 5, 6-F ₃
15	H	i-Pr	F	Cl	H
	H	i-Pr	F	Br	5-CF ₃
	H	i-Pr	F	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	F	CF (CF ₃) ₂	H
20	H	i-Pr	F	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	F	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	F	OCF ₃	H
	H	i-Pr	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	F	O (Ph-2-Cl-4-CF ₃)	H
25	H	i-Pr	F	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	F	S (Ph-2-Cl-4-CF ₃)	5-Cl
	H	i-Pr	F	4-OCF ₂ O-5	
	H	i-Pr	Cl	H	H
	H	i-Pr	Cl	H	3-Cl
30	H	i-Pr	Cl	H	5-Cl
	H	i-Pr	Cl	H	6-Cl
	H	i-Pr	Cl	F	H
	H	i-Pr	Cl	Cl	H
	H	i-Pr	Cl	Cl	3-Cl
35	H	i-Pr	Cl	CH ₃	H
	H	i-Pr	Cl	CF ₃	H
	H	i-Pr	Cl	CF ₃	6-Cl
	H	i-Pr	Cl	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	i-Pr	Cl	CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	Cl	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	Cl	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	Cl	OCF ₃	H
	H	i-Pr	Cl	OCF ₂ CHFCF ₃	5-Cl
45	H	i-Pr	Cl	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	Cl	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	Cl	3-OCHFCH ₂ O-4	

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

138

	H	i-Pr	Cl	3-OCF ₂ CHFO-4	
	H	i-Pr	Cl	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
	H	i-Pr	Cl	3-N=C(CF ₃)O-4	
	H	i-Pr	Cl	4-OCF ₂ O-5	
5	H	i-Pr	Cl	4-OCHF ₂ CF ₂ O-5	
	H	i-Pr	Cl	4-OCF ₂ CHFO-5	
	H	i-Pr	Cl	4-OCF ₂ CF ₂ O-5	
	H	i-Pr	Cl	3-OCHF ₂ CF ₂ O-4-5-Cl	
	H	i-Pr	Cl	3-OCHF ₂ CF ₂ O-4-6-Cl	
10	H	i-Pr	Br	H	H
	H	i-Pr	Br	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	Br	CF(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	Br	CF(CF ₃) ₂	5-CH ₃
	H	i-Pr	Br	C(CF ₃) ₂ OH	H
15	H	i-Pr	Br	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	Br	OCF ₃	H
	H	i-Pr	Br	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	Br	O(L-45d)	H
	H	i-Pr	Br	4-OCF ₂ CHFO-5	
20	H	i-Pr	Br	4-OCHF ₂ CF ₂ O-5-3-Br	
	H	i-Pr	Br	4-OCF ₂ CHFO-5-3-Br	
	H	i-Pr	Br	3-OCHF ₂ CF ₂ O-4-5-Br	
	H	i-Pr	Br	3-OCF ₂ CHFO-4-5-Br	
	H	i-Pr	Br	3-OCHF ₂ CF ₂ O-4-6-Br	
25	H	i-Pr	Br	3-OCF ₂ CHFO-4-6-Br	
	H	i-Pr	I	4-OCF ₂ O-5	
	H	i-Pr	CH ₃	H	H
	H	i-Pr	CH ₃	H	3-F
	H	i-Pr	CH ₃	H	3-Cl
30	H	i-Pr	CH ₃	H	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	H	3-CF ₃
	H	i-Pr	CH ₃	H	3-OCH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	H	3-OCHF ₂
	H	i-Pr	CH ₃	H	3-OCF ₂ CHFC1
35	H	i-Pr	CH ₃	H	5-F
	H	i-Pr	CH ₃	H	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	H	5-Br
	H	i-Pr	CH ₃	H	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	H	5-CF ₂ CF ₃
40	H	i-Pr	CH ₃	H	5-(L-22a)
	H	i-Pr	CH ₃	H	5-O(L-45d)
	H	i-Pr	CH ₃	H	6-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	H	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	F	H
45	H	i-Pr	CH ₃	Cl	H
	H	i-Pr	CH ₃	Cl	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	Cl	5-Cl

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

139

	H	i-Pr	CH ₃	Cl	5-O (L-45d)
	H	i-Pr	CH ₃	Br	H
	H	i-Pr	CH ₃	Br	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	I	H
5	H	i-Pr	CH ₃	CH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CH ₃	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	CH ₃	3-OCHF ₂
	H	i-Pr	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃
10	H	i-Pr	CH ₃	CH ₂ CH ₂ Bu-t	H
	H	i-Pr	CH ₃	CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ CF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ CF ₃	5-Cl
15	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ CF ₃	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ CF ₃	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	3-CH ₃
20	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	5-F
	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) CF ₂ CF ₃	H
25	H	i-Pr	CH ₃	CF ₂ (CF ₂) ₄ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CH ₃) OH	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CH ₃) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OEt	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OPr-n	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OPr-i	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OBu-n	H
35	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OHex-n	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CF=CF ₂	H
40	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CCl ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ C≡CH	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ Cl) OH	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ Cl) OCH ₃	H
45	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ Br) OH	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ Br) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ CF ₃) OH	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

140

	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ CF ₃) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (Pr-i) OH	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (Pr-i) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (Pr-c) OH	H
5	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) (Pr-c) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CH ₂ SCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CH ₂ SCF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	CH ₂ (Ph-4-Cl)	H
	H	i-Pr	CH ₃	CH (Ph-4-Cl) OH	H
10	H	i-Pr	CH ₃	OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCH ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OPr-i	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
15	H	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
20	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	5-CH ₃
25	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl
30	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
35	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	6-CH ₃
40	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	5-Cl
45	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	3, 5-Cl ₂

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

141

	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	5-Cl
5	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	3-Cl
10	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CFCI ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CCl ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCH(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	H
15	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	5-CH ₃
20	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
25	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	6-CH ₃
30	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-Cl
35	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃	OCH ₂ SCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OC(CF ₂ CF ₃)=C(CF ₃) ₂	H
40	H	i-Pr	CH ₃	OC(OCH ₃)=C(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Ph	H
	H	i-Pr	CH ₃	O(Ph-2-Cl)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O(Ph-3-Cl)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O(Ph-4-Cl)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O(Ph-3-CF ₃)	H
45	H	i-Pr	CH ₃	O(Ph-4-CF ₃)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O(Ph-3-CN)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O(Ph-2-Cl-4-CF ₃)	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

142

	H	i-Pr	CH ₃	OC ₆ F ₅	H
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45b)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45c)	H
5	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45c)	3-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45c)	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45c)	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	3-Cl
10	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	5-Cl
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	3, 5-Cl ₂
15	H	i-Pr	CH ₃	O (L-48a)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-48b)	H
	H	i-Pr	CH ₃	O (L-48c)	H
	H	i-Pr	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	OP (S) (OCH ₃) ₂	H
20	H	i-Pr	CH ₃	4-CF ₂ CF ₂ O-5	
	H	i-Pr	CH ₃	4-OCF ₂ O-5	
	H	i-Pr	CH ₃	4-OCHF ₂ CF ₂ O-5	
	H	i-Pr	CH ₃	4-OC (CF ₃)=N-5	
	H	i-Pr	CH ₃	SF ₅	H
25	H	i-Pr	CH ₃	SCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	SCH ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	SP _r -i	H
	H	i-Pr	CH ₃	SCHF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	SCF ₃	H
30	H	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ Br	H
	H	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	S (Ph-3-Cl)	H
35	H	i-Pr	CH ₃	S (Ph-4-Cl)	H
	H	i-Pr	CH ₃	S (O) CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	S (O) CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H
40	H	i-Pr	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	NO ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃	NO ₂	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃	N (CH ₃) C (O) CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	N (CH ₃) C (O) CF ₂ CF ₃	H
45	H	i-Pr	CH ₃	N (CH ₃) C (O) CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (O) CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (O) Ph-4-Cl	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (CH ₃)=NOCH ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

143

	H	i-Pr	CH ₃	C (Ph-4-Cl) =NOH	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (Ph-4-Cl) =NOCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (O) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	C (O) OCH ₂ CF ₃	H
5	H	i-Pr	CH ₃	C (O) N (CH ₃) Ph-4-Cl	H
	H	i-Pr	CH ₃	CN	H
	H	i-Pr	CH ₃	C≡CBu-t	H
	H	i-Pr	CH ₃	C≡CPh	H
	H	i-Pr	CH ₃	C≡C (Ph-2, 4-Cl ₂)	H
10	H	i-Pr	CH ₃	Ph-4-Cl	H
	H	i-Pr	CH ₃	Ph-4-CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	Ph-4-OCF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	L-14c	H
	H	i-Pr	CH ₃	L-22a	H
15	H	i-Pr	CH ₃	L-24a	H
	H	i-Pr	CH ₃	L-36a	H
	H	i-Pr	CH ₃	Si (CH ₃) ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃	Si (CH ₃) ₂ Bu-t	H
	H	i-Pr	CH ₃	Si (CH ₃) ₂ Ph	H
20	H	i-Pr	CH ₃	P (O) (OEt) ₂	H
	H	i-Pr	Et	H	H
	H	i-Pr	Et	H	5-F
	H	i-Pr	Et	H	6-Et
	H	i-Pr	Et	H	3-Cl-6-Et
25	H	i-Pr	Et	Cl	H
	H	i-Pr	Et	I	H
	H	i-Pr	Et	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	Et	CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	Et	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	i-Pr	Et	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	Et	OCF ₃	H
	H	i-Pr	Et	OCF ₂ Br	H
	H	i-Pr	Et	OCF ₂ CHFCI	H
	H	i-Pr	Et	OCF ₂ CHFBr	H
35	H	i-Pr	Et	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	i-Pr	Et	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	i-Pr	Et	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	Et	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	n-Pr	I	H
40	H	i-Pr	n-Pr	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	n-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	i-Pr	I	H
	H	i-Pr	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	i-Pr	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H	i-Pr	i-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	i-Pr	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	n-Bu	I	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

144

	H	i-Pr	CF ₃	H	H
	H	i-Pr	CF ₃	Cl	H
	H	i-Pr	CF ₃	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CF ₃	OCHF ₂	H
5	H	i-Pr	CF ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Br	H
	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	OCH ₃	H	H
	H	i-Pr	OCH ₃	H	5-Ph
10	H	i-Pr	OCH ₃	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	OCH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	OCH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	OCH ₃	OCF ₃	H
15	H	i-Pr	OCH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	i-Pr	OCH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	i-Pr	OCH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
	H	i-Pr	OCH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	i-Pr	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
20	H	i-Pr	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	OCH ₃	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	OEt	CF(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	OEt	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	OEt	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	H	i-Pr	OEt	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	OPh	CF(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	OPh	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	OPh	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	OPh	O (L-45d)	H
30	H	i-Pr	SCH ₃	H	H
	H	i-Pr	SCH ₃	CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	SCH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	SCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	H	i-Pr	SCH ₃	O (L-45d)	H
	H	i-Pr	Ph	CF(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	L-14a	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	L-14b	CF(CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr		2-(CH ₂) ₄ -3-4-CF(CF ₃) ₂	
40	H	i-Pr		2-OCF ₂ O-3	
	H	i-Pr		2-OCF ₂ O-3-6-Cl	
	H	i-Pr		2-N=CHS-3-4-CF(CF ₃) ₂	
	4-F	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
45	4-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OEt	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

145

	4-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CF ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CF=CF ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CCl ₂	H
5	4-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ C≡CH	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
10	4-F	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	6-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	H
15	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	3-Cl
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	3-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	5-Cl
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₃	5-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	H
20	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	5-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	6-CH ₃
25	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3-Cl
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	5-Cl
30	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	5-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
35	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	O (Ph-4-CF ₃)	H
40	4-F	i-Pr	CH ₃	O (Ph-2-Cl-4-CF ₃)	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	O (L-45b)	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	O (L-45c)	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	O (L-45d)	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
45	4-F	i-Pr	CH ₃	SF ₅	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	SCF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ Br	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

146

	4-F	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ CF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	S(O)CF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
5	4-Cl	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
10	4-Cl	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-Cl	i-Pr	CH ₃	O(Ph-2-Cl-4-CF ₃)	H
15	4-Cl	i-Pr	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	O(L-45d)	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	5-F	i-Pr	CH ₃	O(L-45d)	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	6-F	i-Pr	CH ₃	O(L-45d)	H
	4,5-F ₂	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4,5-F ₂	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4,5-F ₂	i-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4,5-F ₂	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	4,5-F ₂	i-Pr	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	c-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	c-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	c-Pr	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₃	H
45	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

147

	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
5	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	c-Pr	CH ₃	O (L-45d)	H
10	4-F	c-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-Cl	c-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CF ₃	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	5-F	c-Pr	CH ₃	O (L-45d)	H
	6-F	c-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	H	n-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	n-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	n-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	n-Bu	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	i-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	H	i-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Bu	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	CH ₂ Pr-c	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	s-Bu	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	H	s-Bu	Cl	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	Br	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	s-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	s-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
30	H	s-Bu	CH ₃	OCHF ₂	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	H	s-Bu	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
35	H	s-Bu	CH ₃	OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₃	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₃	3-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₃	5-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₃	3, 5-Cl ₂
40	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	3-CH ₃
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	5-CH ₃
45	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3-Cl

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

148

	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	5-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	3-Cl
5	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	5-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
10	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-Cl
15	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	s-Bu	CH ₃	O (L-45d)	3-Cl
	H	s-Bu	CH ₃	O (L-45d)	5-Cl
20	H	s-Bu	CH ₃	O (L-45d)	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu	CH ₃	SF ₅	H
	H	s-Bu	Et	CF ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu	Et	C (CF ₃) ₂ OH	H
25	H	s-Bu	Et	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	s-Bu	Et	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu	Et	O (L-45d)	H
	H	s-Bu	OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	OCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	s-Bu	OCH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	s-Bu	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu	OCH ₃	O (L-45d)	H
	H	s-Bu	OEt	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	OEt	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	H	s-Bu	OEt	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	s-Bu	OEt	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu	OEt	O (L-45d)	H
	H	s-Bu	SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	SCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	H	s-Bu	SCH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-F	s-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-Cl	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CF ₃	s-Bu	CH ₃	O (L-45d)	H
	5-F	s-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
45	6-F	s-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	H	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	H	CF (CF ₃) ₂	3-F

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

149

5	H	t-Bu	H	3-OCF ₂ O-4	
	H	t-Bu	H	3-OCHF CF ₂ O-4	
	H	t-Bu	H	3-OCF ₂ CHFO-4	
	H	t-Bu	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
	H	t-Bu	H	3-OC (CF ₂ CF ₃)=N-4	
	H	t-Bu	H	3-N=C (CF ₂ CF ₃) O-4	
	H	t-Bu	H	3-N=C (CF ₂ CF ₂ CF ₃) O-4	
	H	t-Bu	H	3-N=C (Ph-4-CF ₃) O-4	
10	H	t-Bu	F	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	t-Bu	F	4-OCF ₂ O-5	
	H	t-Bu	Cl	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	Cl	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	H	t-Bu	Cl	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
	H	t-Bu	Cl	3-N=C (CF ₃) O-4	
	H	t-Bu	Cl	4-OCF ₂ O-5	
	H	t-Bu	Cl	4-OCF ₂ CF ₂ O-5	
	H	t-Bu	Br	CF ₂ CF ₃	H
20	H	t-Bu	Br	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	CF ₂ CF ₃	3-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃	CF ₂ CF ₃	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	CF ₂ CF ₃	5-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	3-CH ₃
25	H	t-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	5-F
	H	t-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCHF ₂	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
30	H	t-Bu	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃	OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
35	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₃	3-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₃	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₃	3, 5-Cl ₂
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	H
40	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	3-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	5-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
45	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3, 5-Cl ₂

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

150

	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	3-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	3, 5-Cl ₂
5	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
10	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂
15	H	t-Bu	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	t-Bu	CH ₃	O (L-45d)	3-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	O (L-45d)	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃	O (L-45d)	3, 5-Cl ₂
	H	t-Bu	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
20	H	t-Bu	CH ₃	SF ₅	H
	H	t-Bu	CH ₃	SCF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	SCF ₂ Br	H
	H	t-Bu	CH ₃	S (O) CF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
25	H	t-Bu	CH ₃	4-OCHF ₂ CF ₂ O-5	
	H	t-Bu	Et	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	Et	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	Et	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	t-Bu	Et	OCF ₃	H
30	H	t-Bu	Et	OCF ₂ Br	H
	H	t-Bu	Et	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	t-Bu	Et	O (L-45d)	H
	H	t-Bu	Pr-i	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	CF ₃	CF ₂ CF ₃	H
35	H	t-Bu	OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	OCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	OCH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	t-Bu	OCH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	t-Bu	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	t-Bu	OCH ₃	O (L-45d)	H
	H	t-Bu	OEt	CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	OEt	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	OEt	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	t-Bu	SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
45	H	t-Bu	SCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	SCH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	t-Bu		2-(CH ₂) ₄ -3-4-CF (CF ₃) ₂	

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

152

	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ Br	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ Br	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
5	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ Br	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ Br	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CHBrCH ₂ Br	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
10	H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	H	CH ₂ CH ₂ OPh	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ O(Ph-2-Cl)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ O(Ph-3-Cl)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ O(Ph-4-Cl)	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH(OH)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	H	CH ₂ CH(OH)Et	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH(OH)Ph	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH(OH)CH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OH	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
25	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OEt	H
30	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CF ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CF=CF ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CCl ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ Cl)OH	H
35	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ Cl)OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ CF ₃)OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ CF ₃)OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
40	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₃	H
45	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₃	3-Cl
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₃	5-Cl
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₃	3, 5-Cl ₂

PCT/JP02/07833

[illegible]

CH ₃	OCF ₂ Br	H
CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl
CH ₃	OCF ₂ Br	3-CH ₃
CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl
CH ₃	OCF ₂ Br	5-CH ₃
CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3-Cl
CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	5-Cl
CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3, 5-Cl ₂
CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
CH ₃	OCF ₂ CHFC1	3-Cl
CH ₃	OCF ₂ CHFC1	5-Cl
CH ₃	OCF ₂ CHFC1	3, 5-Cl ₂
CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-Cl
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-Cl
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂
CH ₃	O (L-45d)	H
CH ₃	O (L-45d)	3-Cl
CH ₃	O (L-45d)	5-Cl
CH ₃	O (L-45d)	3, 5-Cl ₂
CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
CH ₃	SF ₅	H
CH ₃	SCF ₃	H
CH ₃	SCF ₂ Br	H
CH ₃	S (O) CF ₃	H
CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
CH ₃	O (L-45d)	H
CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
CH ₃	O (L-45d)	H
CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

154

	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₂ Ph	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
5	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
10	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
15	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4-Cl	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	O(L-45d)	H
	5-F	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
25	6-F	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHPr-n	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHPr-i	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHPr-c	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHBu-t	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
30	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHCH ₂ Ph	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
35	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHPh	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)N(Et) ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)N(Pr-i) ₂	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)N(CH ₃)Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)(T-19)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)(T-22)	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)(T-23)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)(T-24)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OP(O)(OEt) ₂	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
45	H	CH(CH ₃)CH ₂ OP(S)(OCH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OP(S)(OEt) ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ OPh	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

155

5	H	CH(CH ₃)CH ₂ O(Ph-4-Cl)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ O(Ph-3-CF ₃)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(Et)CH ₂ OH	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(Et)CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(Ph)CH ₂ OH	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	(R)-CH(Ph)CH ₂ OH	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(Ph-2-Cl)CH ₂ OH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(Ph-4-Cl)CH ₂ OH	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(Ph-4-Ph)CH ₂ OH	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
10	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	H
15	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
20	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SF ₅	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SCF ₂ Br	H
30	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	S(O)CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
	4-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-Cl	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-CF ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
35	5-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	6-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)CF ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
40	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
45	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

156

	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-Cl	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	5-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	6-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₃	H
15	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
20	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	O(L-45d)	H
25	4-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-Cl	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4-CF ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	5-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	O(L-45d)	H
	6-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
30	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHPr-n	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHPr-i	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHPr-c	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
35	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₂ Ph	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OP(S)(OCH ₃) ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH(OEt) ₂	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
45	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OPr-n	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OBu-i	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

157

	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC(O)NHEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	T-10	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	H	M-4a	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	M-5a	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ (M-16a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (M-24a)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
10	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	H	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ SPR-i	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH(CH ₃)SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
20	H	CH ₂ CH(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH(CH ₃)SEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH(CH ₃)SO ₂ Et	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	Cl	CF(CF ₃) ₂	H
25	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
30	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OEt	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CF ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CCl ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CF=CF ₂	H
35	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ C≡CH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ Cl)OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ Cl)OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ CF ₃)OH	H
40	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ CF ₃)OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
45	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

158

	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OC(CF ₂ CF ₃)=C(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SF ₅	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SCF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	Et	CF(CF ₃) ₂	H
10	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-Cl	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	5-F	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	6-F	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
20	H	CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
25	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
30	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	SF ₅	H
	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-Cl	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
35	4-CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	5-F	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	6-F	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
40	H	(S)-CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ S(O)Et	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
45	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ Et	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SPr-n	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH ₂ SPr-i	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

159

	H	CH (CH ₃) CH ₂ SBu-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SBu-i	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SBu-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Bu-t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	H	CH (CH ₃) CH ₂ SHex-n	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SHex-c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (O) CH ₂ CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-Cl
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ OH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (O) CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (O) CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ OC (O) CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ C (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (O) NHEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
25	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (O) N (CH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (O) N (Et) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (S) NHCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (S) NHEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (S) N (CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ C (O) N (Et) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (O) CH ₂ C (O) N (Et) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ C (O) N (Et) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ (Ph-2, 4-Cl ₂)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SPh	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	H	CH (CH ₃) CH ₂ SPh	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SPh	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-21a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ (L-21a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-35a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-45a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (O) (L-45a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ (L-45a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-48a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (O) (L-48a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ (L-48a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-48b)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (O) (L-48b)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

160

H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ (L-48b)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
H	CH(CH ₃)CH ₂ SSCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
H	CH(CH ₃)CH ₂ SS(Ph-2-NO ₂)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	CH(Et)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
5	H	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
H	CH(CH ₂ SCH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	CH(Ph)CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
H	CH(Ph)CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
H	CH(CH ₃)CH(CH ₃)SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	CH(CH ₃)CH(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
10	H	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
H	CH(CH ₃)CH(CH ₃)SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	CH(CH ₃)CH(CH ₃)SO ₂ Et	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Cl	C(CF ₃) ₂ OH	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
15	H	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OEt	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CF ₂	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CF=CF ₂	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CCl ₂	H
20	H	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ Cl)OH	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ Cl)OCH ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ CF ₃)OH	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C(CF ₃)(CF ₂ CF ₃)OCH ₃	H
25	H	CH ₃	OCF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
30	H	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
35	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SF ₅	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SCF ₃	H
40	H	CH ₃	SCF ₂ Br	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	S(O)CF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Et	CF(CF ₃) ₂	H
45	H	CH ₂ OH	C(CF ₃) ₂ OH	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F
4-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

161

4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
5 4-Cl	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
6-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10 H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	(-) -C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	(+) -C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15 H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20 H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	SF ₅	H
4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
4-Cl	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25 5-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
6-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
30 H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ Br	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFB1	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	O (L-45d)	H
35 H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-n	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) Pr-n	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40 H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Pr-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-i	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-i	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) Pr-i	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Pr-i	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45 H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SBu-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) Bu-t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPh	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

162

5	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₂ (Ph-4-Cl)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (L-45a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (O) (L-45a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ (L-45a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ S (O) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (Et) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	H	CH (CH ₂ OH) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ S (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ S (O) Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ SO ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ (CH ₂) ₃ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	C (CH ₃) ₂ (CH ₂) ₃ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH (CH ₃) SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₄ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₄ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₄ SEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₄ S (O) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₄ SO ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CHO) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) (CHO) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) (CHO) CH ₂ SO ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	T-6	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	T-7	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	T-8	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	T-9	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	T-11	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H	T-12	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	T-13	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	T-14	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

163

5	H	T-15	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	M-8a	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	M-9a	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	M-9b	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	M-9c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	M-19a	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ NHC (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ NHC (O) OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ NHC (O) OPr-i	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	CH ₂ CH ₂ NHC (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ NHC (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ NHC (O) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ NHC (O) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ NHC (O) N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	H	CH ₂ CH ₂ NHC (O) Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ NHPh	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (O) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (O) N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
25	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (S) NH ₂ Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHP (S) (OCH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHP (S) (OEt) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) Pr-c	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) Bu-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-1a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-2a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-3a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-4a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-16a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-17a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-20a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-22a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) (L-23a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

164

5	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	O(L-45d)	H
10	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
15	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
20	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	4-Cl	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	4-CF ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	O(L-45d)	H
	5-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	6-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OPr-n	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHC(O)OBu-t	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	M-22a	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	M-22b	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	M-22c	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	M-22d	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	H	M-22e	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CHO	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CHO	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CHO	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	C(CH ₃) ₂ CHO	CH ₃	O(L-45d)	H
	H	CH(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ C(Ph)=NOCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃)CH=NOCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
45	H	CH(CH ₃)CH=NOCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃)CH=NOCH ₃	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH(CH ₃)CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

165

	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOPr-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ Pr-c	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) C (CH ₃) =NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHF	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
20	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
25	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	4-F	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-Cl	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	5-F	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	6-F	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₂ C (O) OBU-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₂ C (O) N (Et) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	H	C (CH ₃) (CH ₂ SO ₂ CH ₃) CH=NOH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) (CH ₂ SO ₂ Et) CH=NOH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=NOEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	H	CH ₂ C (O) OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) C (O) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ C (O) OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ C (O) OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) C (O) NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	H	CH (CH ₃) C (O) NHP r-n	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) C (O) NHBu-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) C (O) NHCH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

166

	H	CH(CH ₃) C(O) N(CH ₃) ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃) C(O) N(Et) ₂	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃) C(O) N(Pr-n) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃) C(O) (T-19)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
5	H	CH(CH ₃) C(O) (T-20)	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃) C(O) (T-21)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃) C(O) (T-22)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃) C(O) (T-23)	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃) C(O) (T-24)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	H	CH(CH ₃) CH ₂ C(O) NHCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃) CH ₂ C(O) NHEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH(CH ₃) CH ₂ C(O) N(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH(CH ₃) CH ₂ C(O) N(Et) ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH(CH ₃) CH ₂ C(O) N(CH ₃) Ph	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
15	H	CH(CH ₃) CN	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₃	H
20	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
25	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	O(L-45d)	H
30	4-F	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	O(L-45d)	H
	4-Cl	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	5-F	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	6-F	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	O(L-45d)	H
35	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH=CHC(O) NHEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH=CHPh(E)	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
40	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₃	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ Br	H
45	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

167

	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CF}_2\text{Br}$	H
	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$	H
	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CFBr}\text{CF}_3$	H
	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_3$	H
5	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
	H	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	O (L-45d)	H
	4-F	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	4-Cl	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	4-CF ₃	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
10	5-F	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	O (L-45d)	H
	6-F	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OCH}_3$	H
15	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	OCF_3	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	OCF_2Br	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	OCF_2CHF_2	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFC1}$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFCBr}$	H
20	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CF}_2\text{Br}$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CFBr}\text{CF}_3$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_3$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
25	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	O (L-45d)	H
	4-F	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	4-Cl	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
	4-CF ₃	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	O (L-45d)	H
	5-F	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
30	6-F	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CPh}$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-CH}_3)$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-CF}_3)$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-OCH}_3)$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
35	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-OCF}_3)$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-2, 4-F}_2)$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-2, 4-Cl}_2)$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-2, 6-Cl}_2)$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CNaph}$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
40	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{L-3a})$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{L-4a})$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{L-45a})$	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{L-45b})$	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H
	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{L-46a})$	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
45	H	CH_2Ph	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	H
	H	CH_2Ph	CH_3	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{OH}$	H
	H	CH_2Ph	CH_3	$\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

168

	H	CH ₂ Ph	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	CH ₂ (Ph-2-F)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ (Ph-2-F)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (Ph-2-Cl)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	H	CH ₂ (Ph-2-Cl)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ (Ph-2-Cl)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (Ph-2-Cl)	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	CH ₂ (Ph-3-Cl)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ (Ph-4-Cl)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	CH ₂ (Ph-2-CH ₃)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (Ph-3-CH ₃)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ (Ph-4-CH ₃)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ (Ph-2-CF ₃)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (Ph-2-OCH ₃)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	H	CH ₂ (Ph-3-OCH ₃)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ (Ph-4-OCH ₃)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (Ph-4-OCF ₃)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ (Ph-2, 3-Cl ₂)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ (Ph-2, 4-Cl ₂)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	H	CH ₂ (Ph-3, 4-Cl ₂)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ (L-45a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ (L-46a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (L-47a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
25	H	CH (CH ₃) Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	(R)-CH (CH ₃) Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	(S)-CH (CH ₃) Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) Ph	CH ₃	O (L-45d)	H
30	H	CH (CH ₃) (Ph-2-Cl)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) (Ph-3-Cl)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) (Ph-4-Cl)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) (L-1a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) (L-3a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	H	CH (CH ₃) (L-45a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ (Ph-3-Cl)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ (Ph-4-Cl)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	CH ₂ CH ₂ (Ph-2-Cl)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ (Ph-3-Cl)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ (Ph-4-Cl)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ (L-46a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	L-1a	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H

WO 03/011028

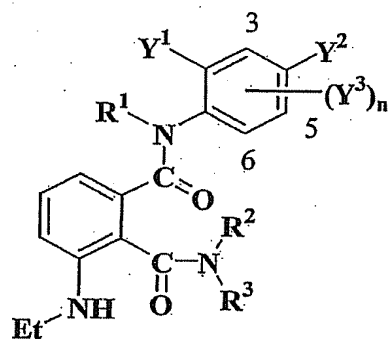
PCT/JP02/07833

169

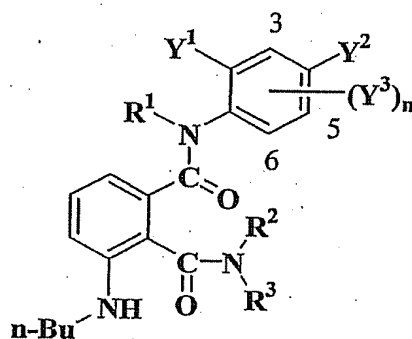
	H	OPr-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	OCH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	NH ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	NHCHO	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	H	NHC (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	NHC (O) Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	NHC (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	NHC (O) OPh	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	NHC (O) OCH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	N (CH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	N (CH ₃)CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	N (CH ₃)C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	N (CH ₃)C (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

15

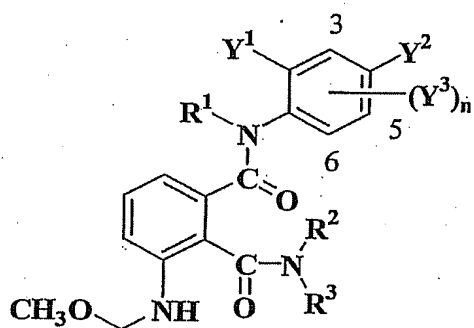
第2表



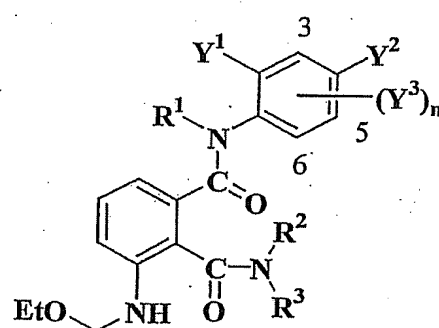
[2] - 1



[2] - 2



[2] - 3

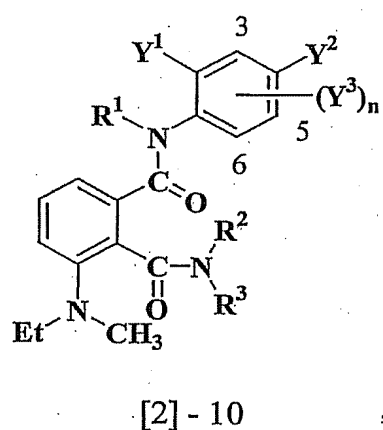
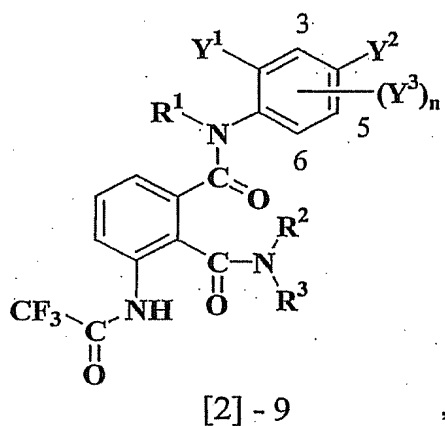
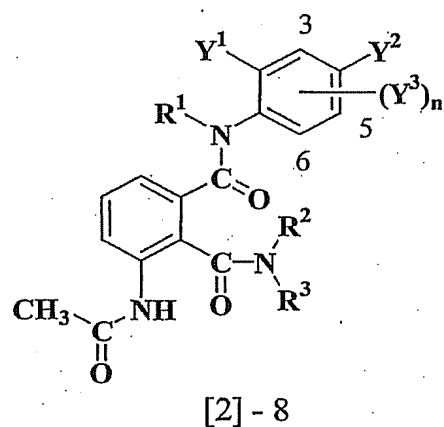
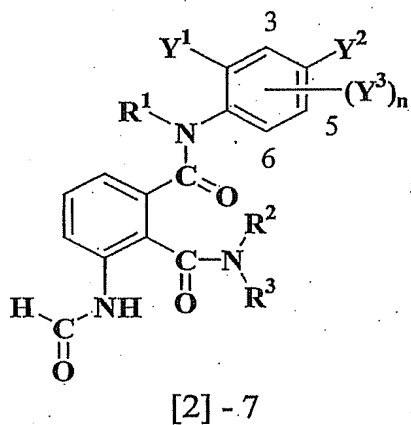
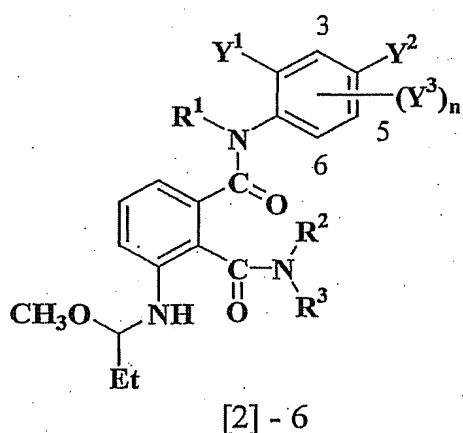
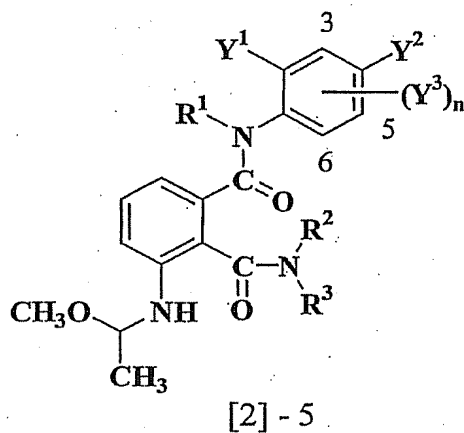


[2] - 4

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

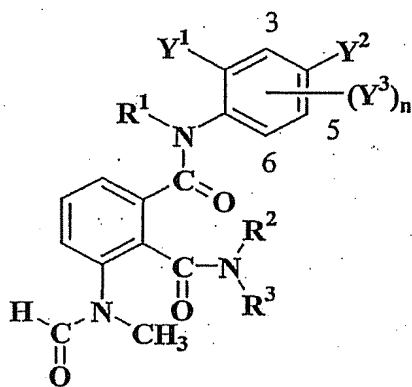
170



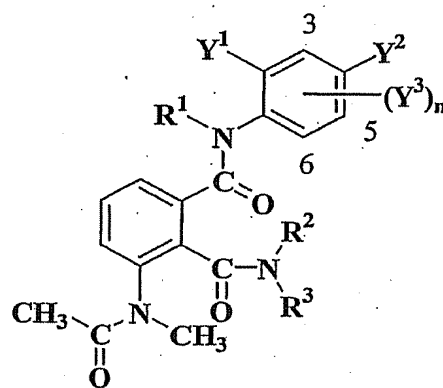
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

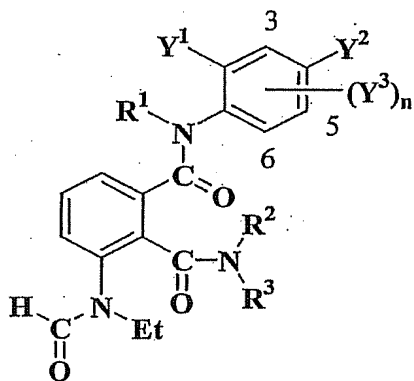
171



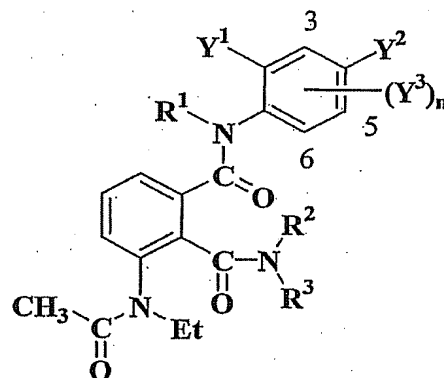
[2] - 11



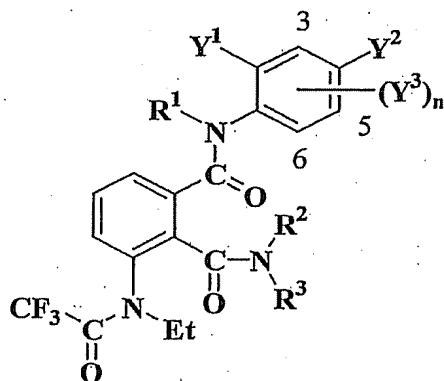
[2] - 12



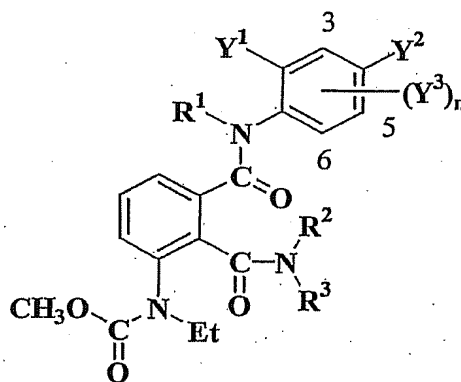
[2] - 13



[2] - 14



[2] - 15

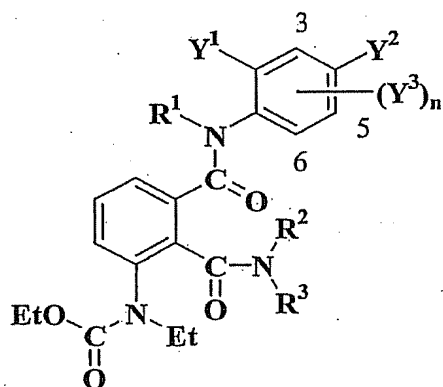


[2] - 16

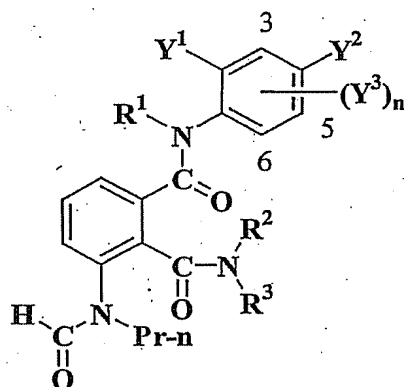
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

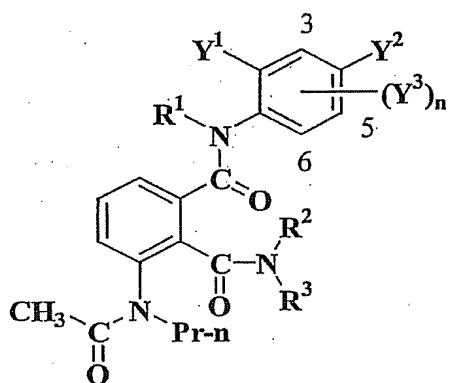
172



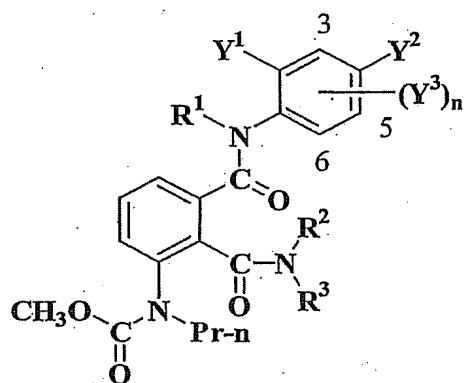
[2] - 17



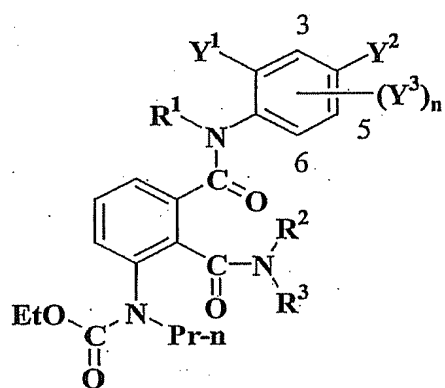
[2] - 18



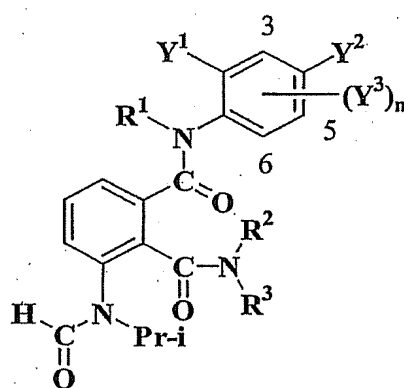
[2] - 19



[2] - 20



[2] - 21

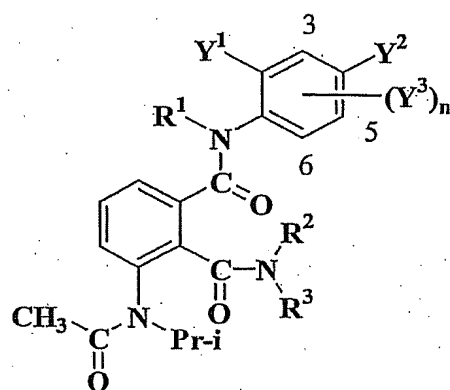


[2] - 22

WO 03/011028

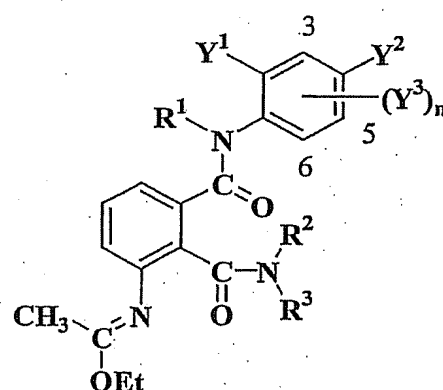
PCT/JP02/07833

173



[2] - 23

または



[2] - 24

	R ¹	R ²	R ³	Y ¹	Y ²	(Y ³) _n
5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	Et	Et	H	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	Et	H	3-OCF ₂ O-4	
	H	Et	Et	H	3-OCHFCF ₂ O-4	
	H	Et	Et	H	3-OCF ₂ CHFO-4	
10	H	Et	Et	H	3-OC(CF ₂ CF ₃)=N-4	
	H	Et	Et	H	3-OC(Ph-2-CF ₃)=N-4	
	H	Et	Et	H	3-N=C(Ph-4-CF ₃)O-4	
	H	Et	Et	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	Et	Cl	CF(CF ₃) ₂	H
15	H	Et	Et	Cl	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	Et	Cl	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	Et	Br	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	Et	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	Et	Et	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
20	H	Et	Et	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCHF ₂	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
	H	Et	Et	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	H	Et	Et	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
25	H	Et	Et	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₃	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
30	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

174

	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	Et	Et	CH ₃	SF ₅	H
	H	Et	Et	CH ₃	SCF ₃	H
5	H	Et	Et	Et	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	Et	Et	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	Et	Et	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	Et	OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	Et	OCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	Et	Et	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₃	Et	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	Et	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ OCH ₃	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ OEt	Et	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	CH ₂ SCH ₃	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SEt	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C (O) CH ₃	Et	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ COOCH ₃	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ COOEt	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	CH ₂ CN	Et	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C≡CH	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₃	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Et	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
25	C (O) Ph	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₃	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OEt	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	CN	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SCCl ₃	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	SPh	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	SN (Et) ₂	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Pr-i) ₂	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (Bu-n) ₂	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	S (T-16)	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	S (T-17)	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	S (T-18)	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	S (T-23)	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (CH ₃) COOEt	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (CH ₃) COOPr-n	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
40	SN (CH ₃) COOBu-n	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (CH ₃) COOHex-n	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (Et) COOEt	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	SN (Et) COOPr-n	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Et) COOBu-n	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	SN (Pr-i) COOEt	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	SN (Pr-i) COOPr-n	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Pr-i) COOBu-n	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

175

	S (O) ₂ CH ₃	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	S (O) ₂ Et	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	S (O) ₂ Ph	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	NHC (O) CH ₃	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
5	H	Et	n-Pr	Cl	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	n-Pr	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	n-Pr	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	n-Pr	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (O) CH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	H	C (O) Et	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (O) Ph	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (O) OCH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (O) OEt	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	SN (Bu-n) ₂	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	H	SO ₂ CH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	NHC (O) CH ₃	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₃	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₃	CH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	Et	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
25	Et	CH ₃	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ OCH ₃	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ OEt	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SEt	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	CH ₂ C (O) CH ₃	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ COOCH ₃	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ COOEt	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CN	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	CH ₂ C≡CH	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₃	H	t-Bu	H	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	H	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	H	Et	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	n-Pr	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	CH ₂ CH ₂ S (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H	Et	CH ₂ CH ₂ S (O) ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

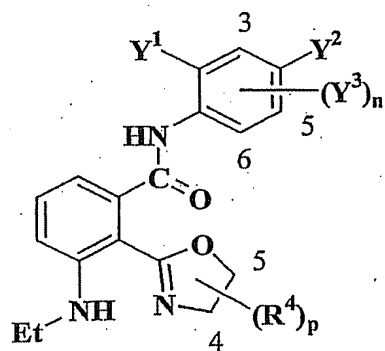
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

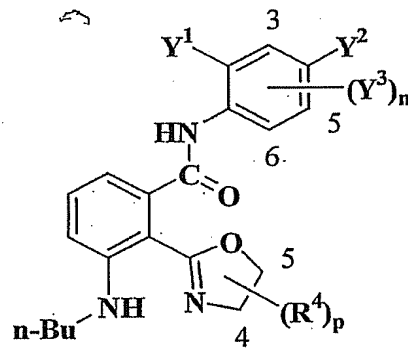
176

	H	Et	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₃	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	H	Et	CH ₂ Ph	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	CH ₃	H	CH(CH ₃)Ph	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	-CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -		CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
10	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
	H	-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ -		CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	-CH ₂ CH(CH ₃)OCH(CH ₃)CH ₂ -		CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H
15	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H

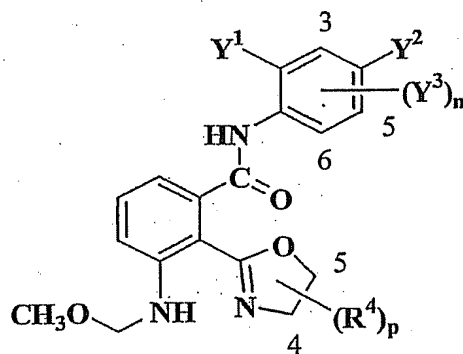
第3表



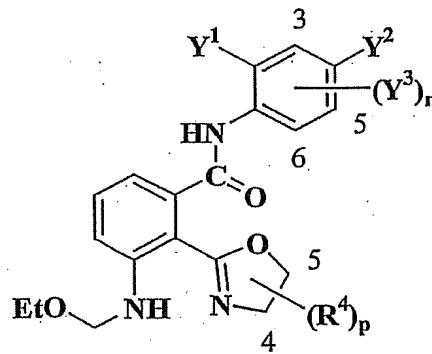
[3] - 1



[3] - 2



[3] - 3

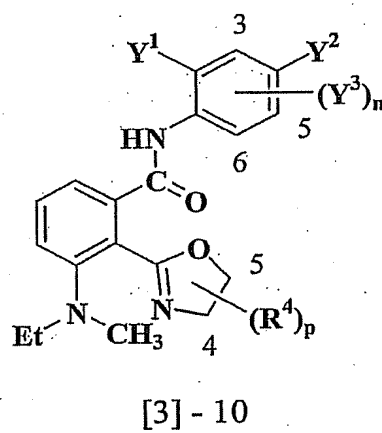
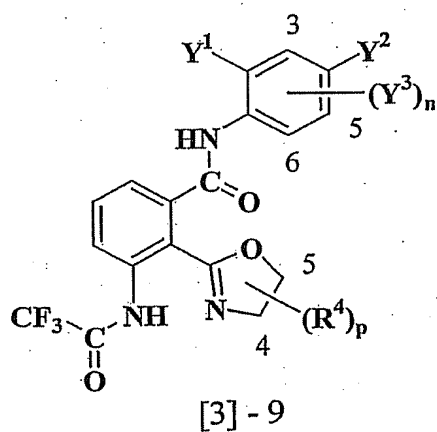
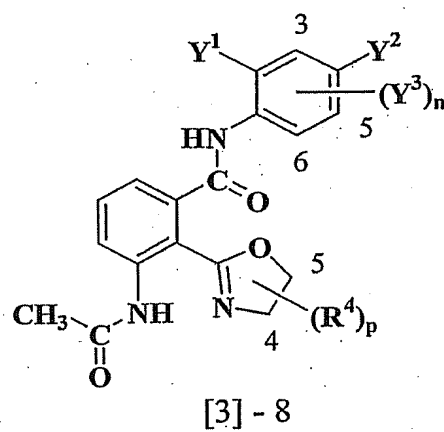
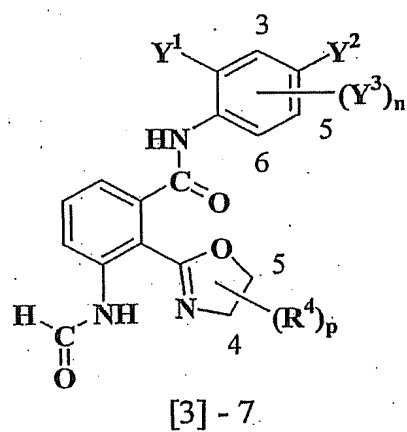
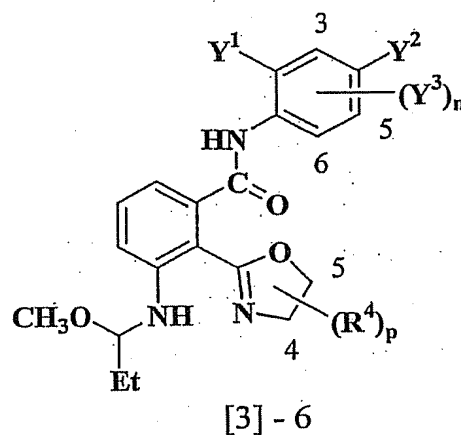
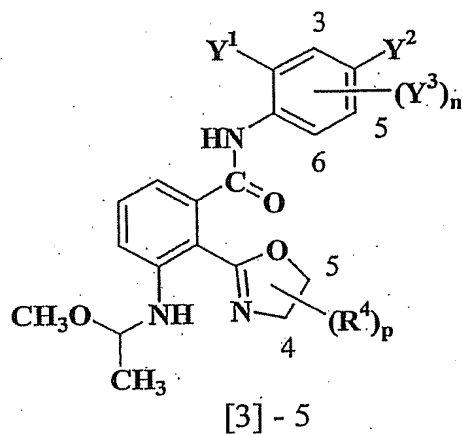


[3] - 4

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

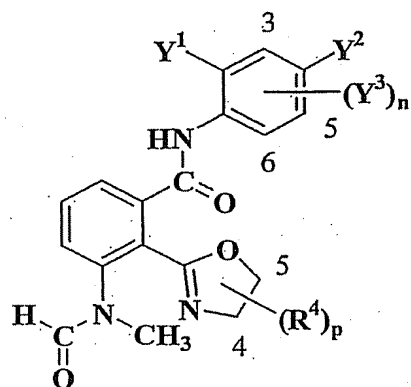
177



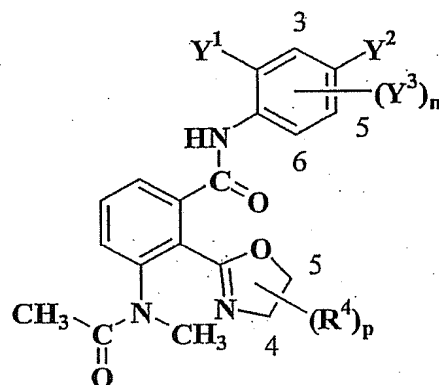
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

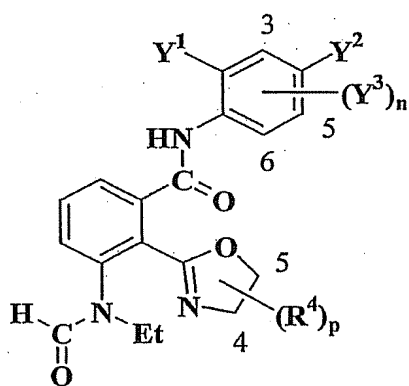
178



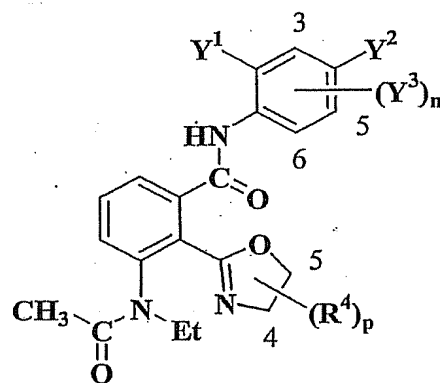
[3] - 11



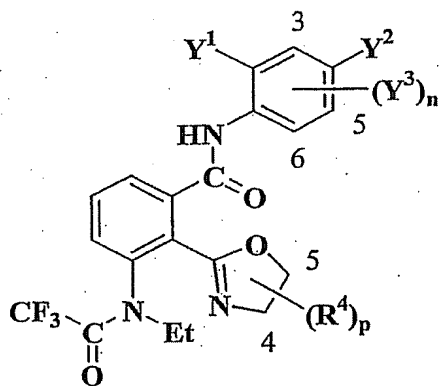
[3] - 12



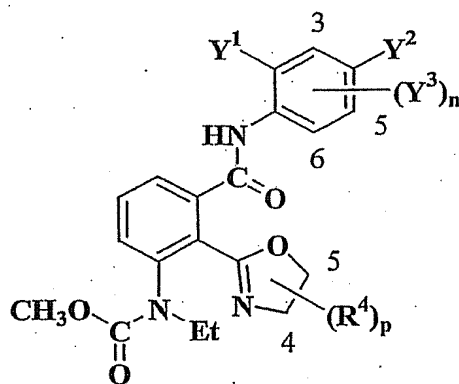
[3] - 13



[3] - 14



[3] - 15

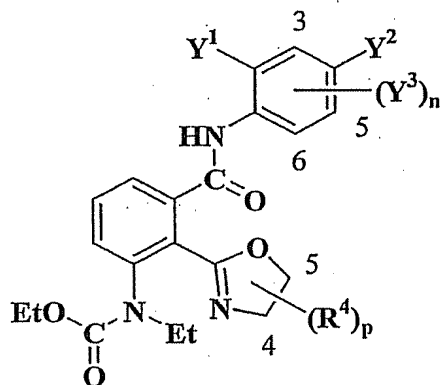


[3] - 16

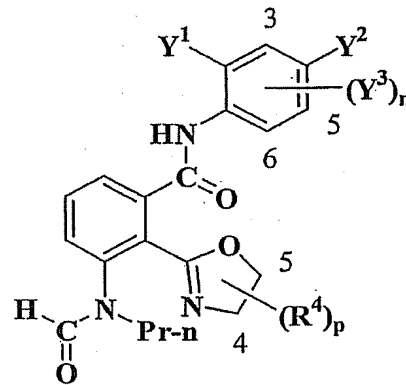
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

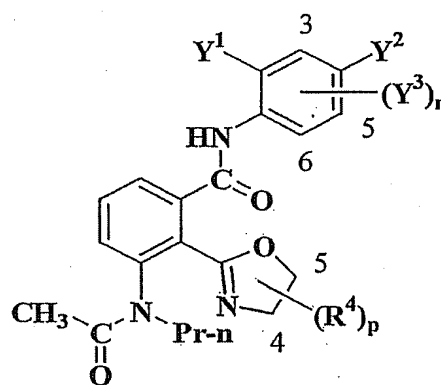
179



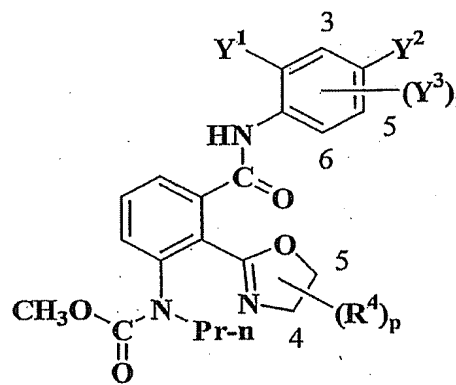
[3] - 17



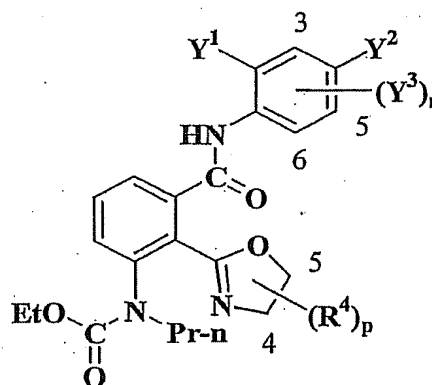
[3] - 18



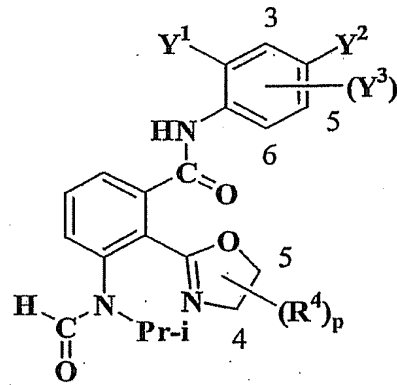
[3] - 19



[3] - 20



[3] - 21

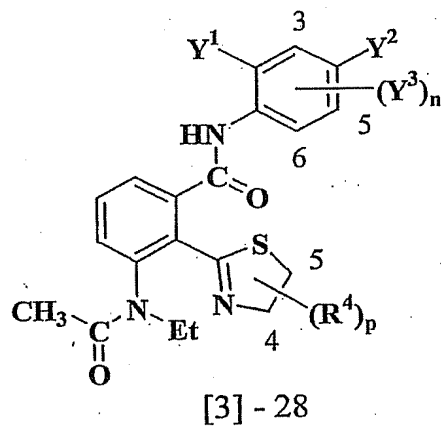
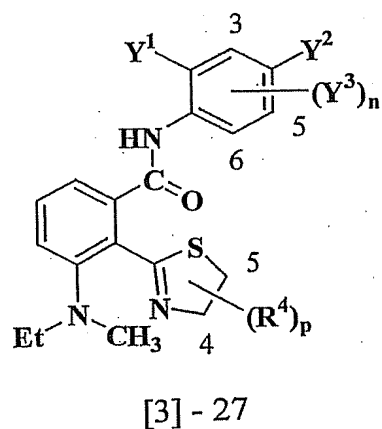
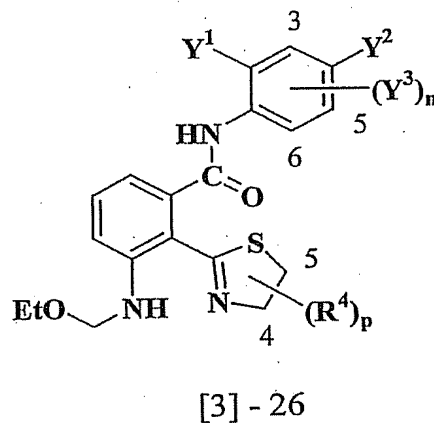
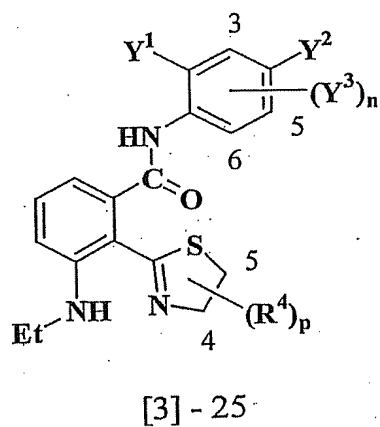
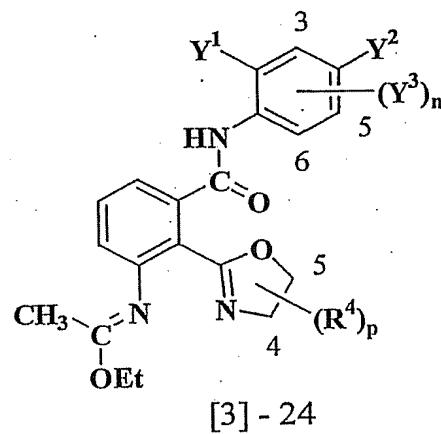
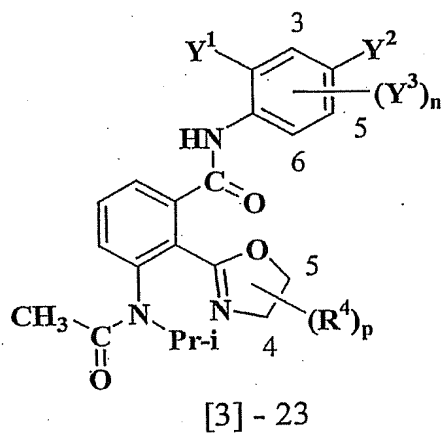


[3] - 22

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

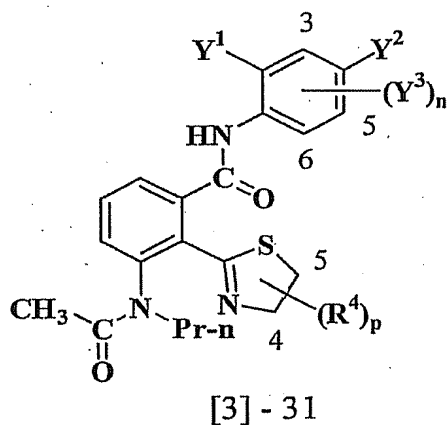
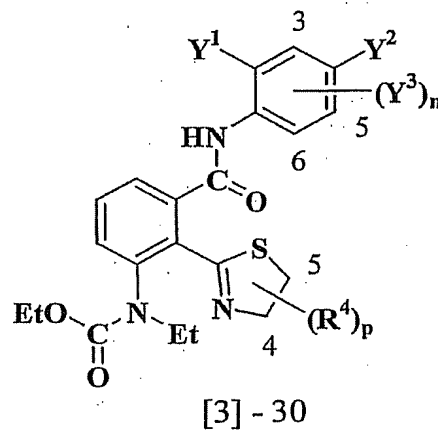
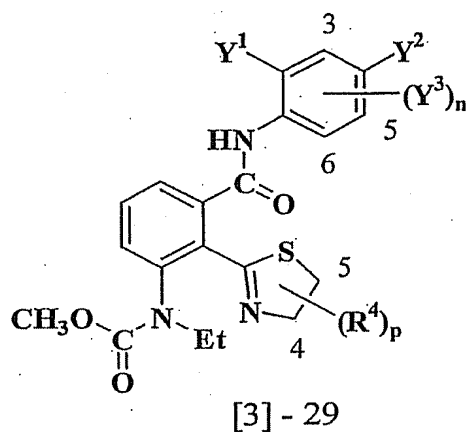
180



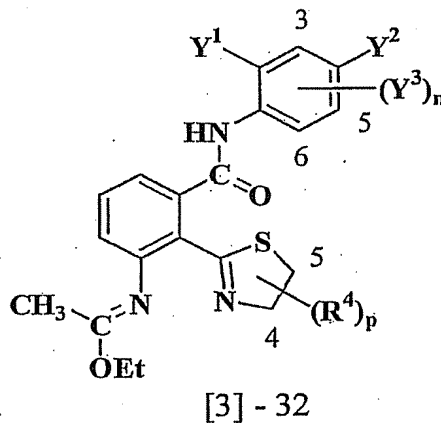
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

181



または



	(R ⁴) _p	Y ¹	Y ²	(Y ³) _n
5	4-CH ₃ (R)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CH ₃ (R)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ (R)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CH ₃ (R)	CH ₃	O (L-45d)	H
10	4-CH ₃ (S)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CH ₃ (S)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ (S)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CH ₃ (S)	CH ₃	O (L-45d)	H
15	4-Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	5-Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-(Ph-4-Bu-t)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	H	3-CF ₂ OCF ₂ O-4	H
20	4, 4-(CH ₃) ₂	Cl	CF (CF ₃) ₂	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	Cl	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

182

	4, 4-(CH ₃) ₂	Cl	3-CF ₂ OCF ₂ O-4	
	4, 4-(CH ₃) ₂	Br	CF (CF ₃) ₂	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	Br	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	CF ₃	H
5	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	3-F
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCHF ₂	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
15	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ Br	H
20	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ Br	3-CH ₃
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ Br	5-CH ₃
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
25	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
30	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	O (L-45d)	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	SF ₅	H
35	4, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	SCF ₂ Br	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	Et	CF (CF ₃) ₂	H
	4, 4-(CH ₃) ₂	OCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
45	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H

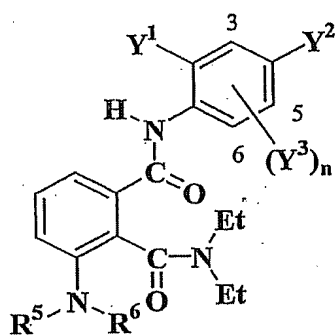
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

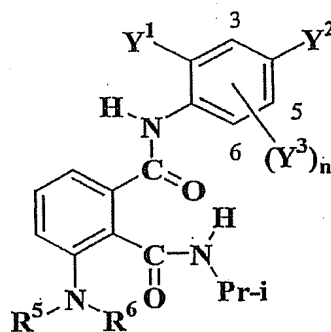
183

	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S(O)Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
25	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

第4表



[4] - 1

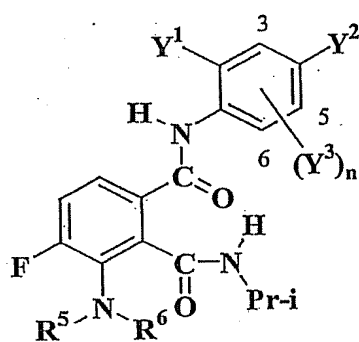


[4] - 2

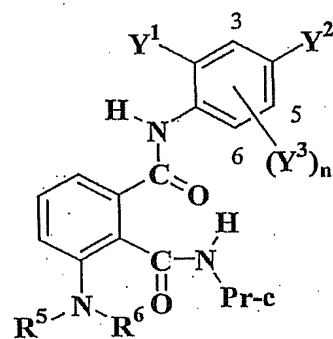
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

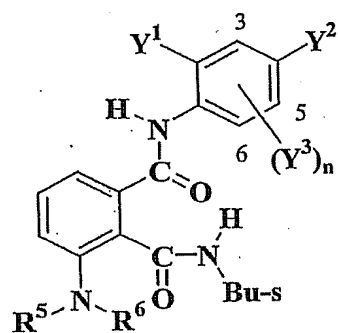
184



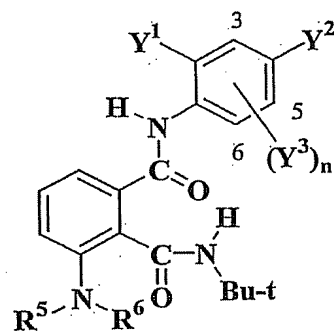
[4] - 3



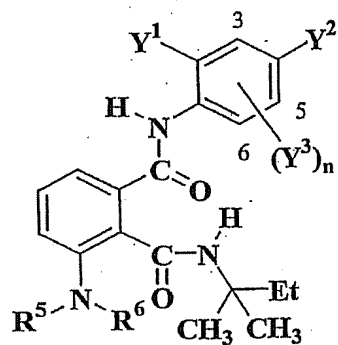
[4] - 4



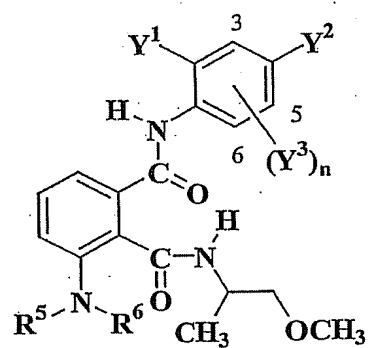
[4] - 5



[4] - 6



[4] - 7

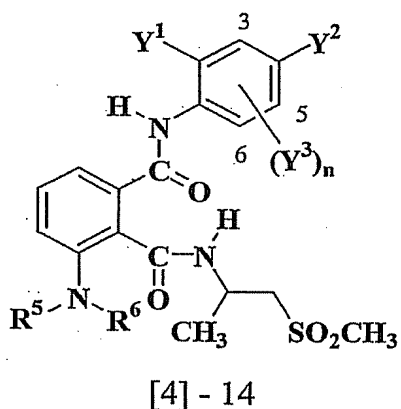
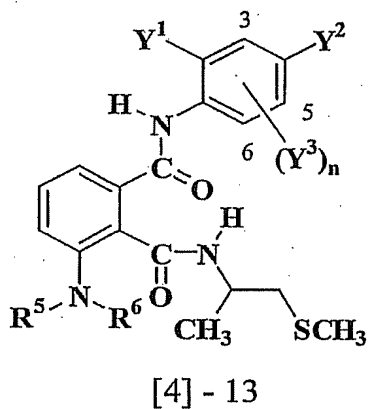
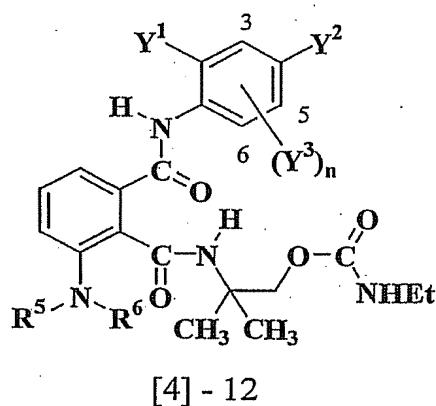
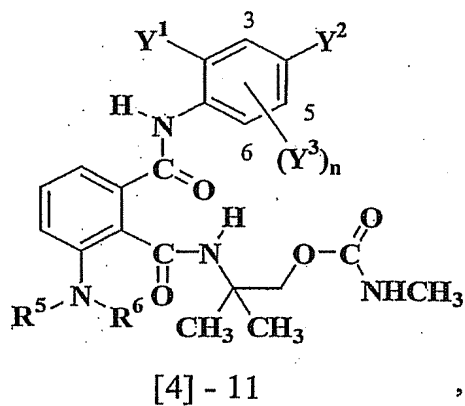
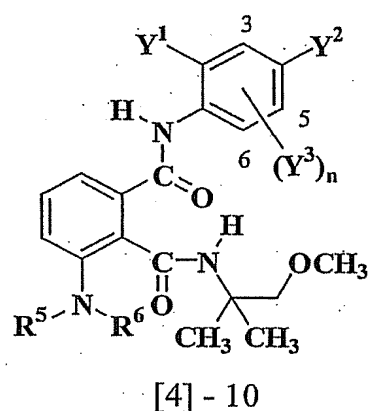
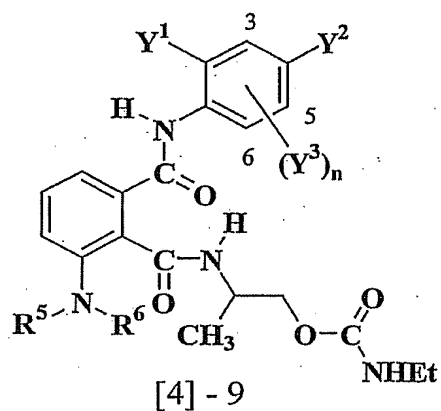


[4] - 8

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

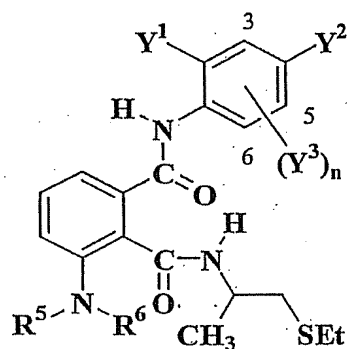
185



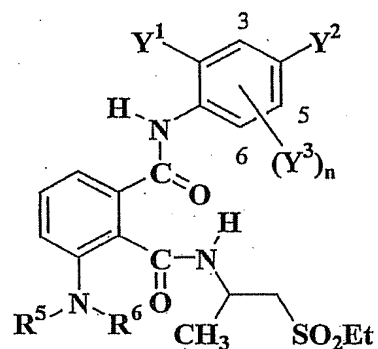
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

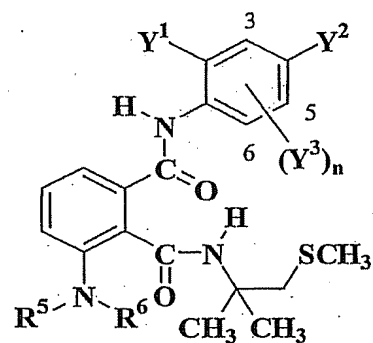
186



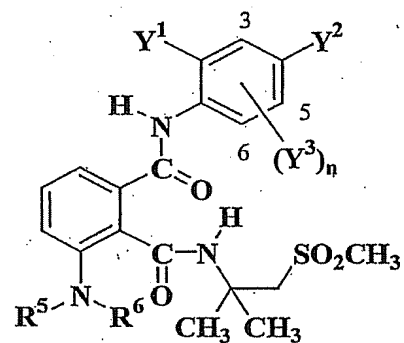
[4] - 15



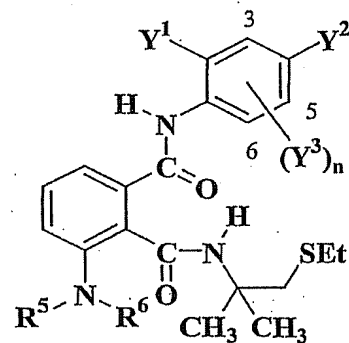
[4] - 16



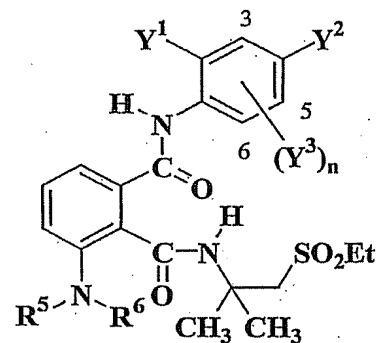
[4] - 17



[4] - 18



[4] - 19

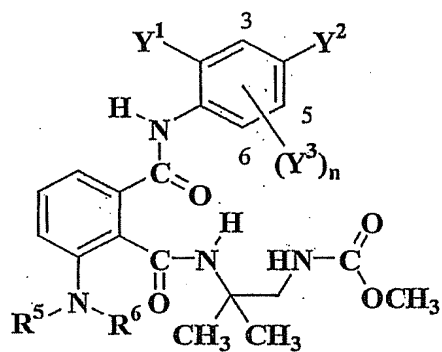


[4] - 20

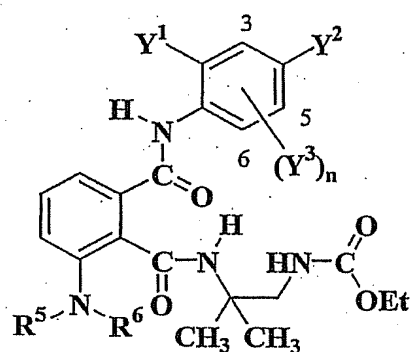
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

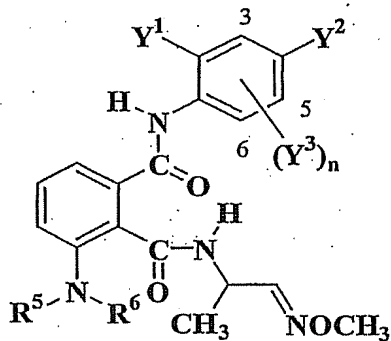
187



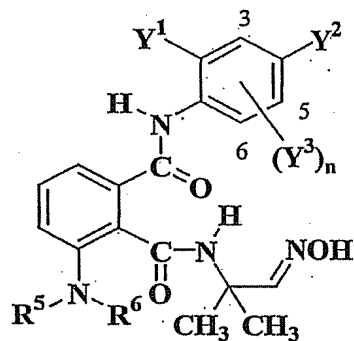
[4] - 21



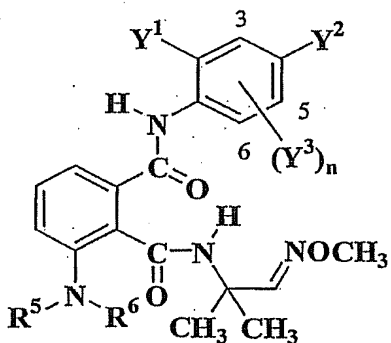
[4] - 22



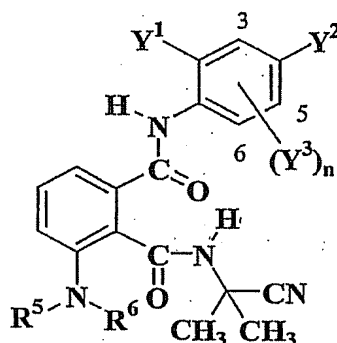
[4] - 23



[4] - 24



[4] - 25

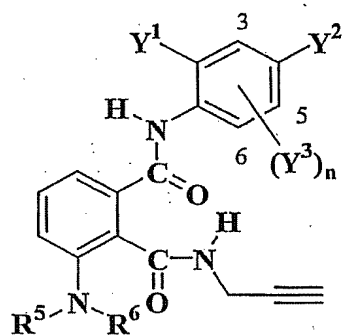


[4] - 26

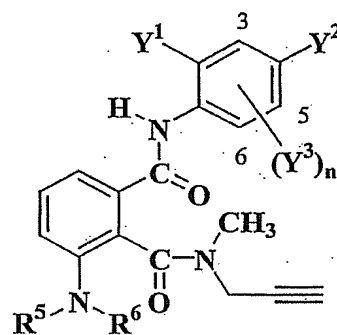
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

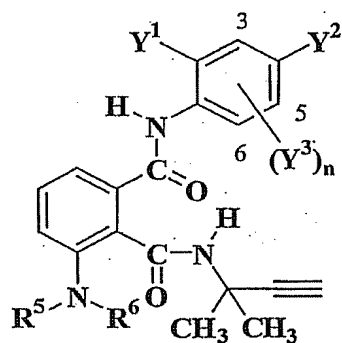
188



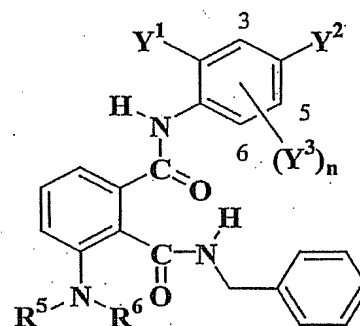
[4] - 27



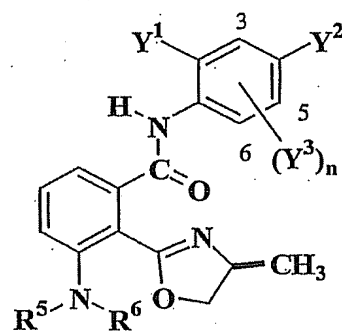
[4] - 28



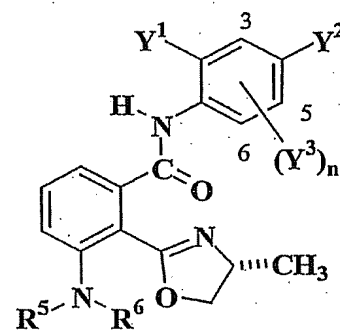
[4] - 29



[4] - 30



[4] - 31

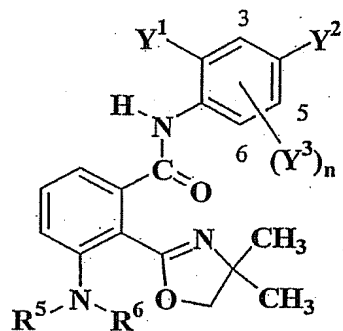


[4] - 32

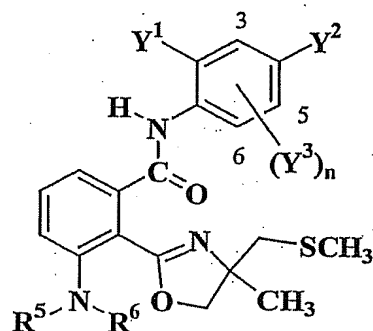
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

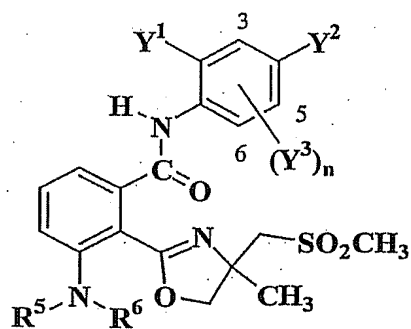
189



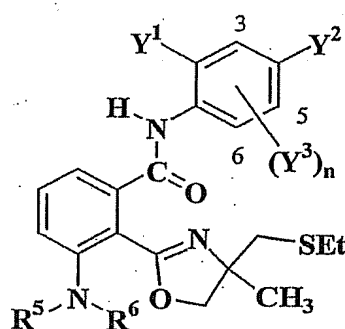
[4] - 33



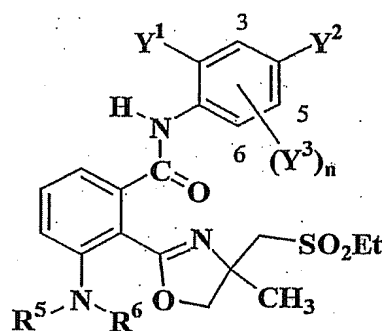
[4] - 34



[4] - 35

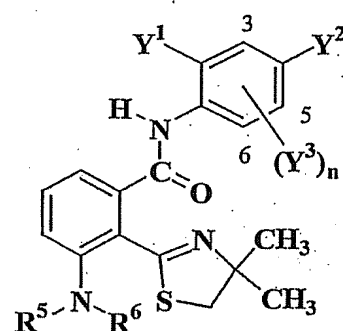


[4] - 36



[4] - 37

または



[4] - 38

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

190

	R ⁵	R ⁶	Y ¹	Y ²	(Y ³) _n
5	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Et	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	Et	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	n-Pr	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	i-Pr	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	c-Pr	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	c-Pr	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	n-Bu	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	i-Bu	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	s-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	n-Pen	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	c-Pen	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	c-Pen	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	n-Hex	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	c-Hex	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	O (L-45d)	H
25	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
	CH ₂ CF ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	CH ₂ CF ₃	CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CF ₃	C (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CF ₃	C (O) Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CF ₃	C (O) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CF ₃	C (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	CH ₂ CF ₃	C (O) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ OCH ₃	CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ OCH ₃	C (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ OCH ₃	C (O) Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ OCH ₃	C (O) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	CH ₂ OCH ₃	C (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ OEt	CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ OEt	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ OEt	C (O) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ OEt	C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	CH ₂ OEt	C (O) OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

191

	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCHF ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
5	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₃	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
10	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFB _r	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	O (L-45d)	H
	CH ₂ SCH ₃	CHO	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	CH ₂ SCH ₃	C (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SCH ₃	C (O) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	C (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	CH ₂ SEt	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	3-Cl
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	5-Cl
25	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₃	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFB _r	H
30	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	O (L-45d)	H
	CH ₂ SEt	CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	CH ₂ SEt	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SEt	C (O) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SEt	C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	CH ₂ SPh	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHFB _r	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	H
45	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	O (L-45d)	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

192

	CH ₂ SPh	CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SPh	C (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SPh	C (O) CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SPh	C (O) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	CH ₂ CN	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CN	CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CN	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CN	C (O) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CN	C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	CH ₂ C (O) OCH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C (O) OCH ₃	CHO	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C (O) OCH ₃	C (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C (O) OCH ₃	C (O) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C (O) OCH ₃	C (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	CH ₂ C (O) NHCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C (O) NHCH ₃	CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C (O) NHCH ₃	C (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C (O) NHCH ₃	C (O) CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C (O) NHCH ₃	C (O) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	CH ₂ C (O) N (CH ₃) ₂	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C (O) N (CH ₃) ₂	CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C (O) N (CH ₃) ₂	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C (O) N (CH ₃) ₂	C (O) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C (O) N (CH ₃) ₂	C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CH=CH ₂	CHO	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CH=CH ₂	C (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CH=CH ₂	C (O) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CH=CH ₂	C (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	CH ₂ CH=CCl ₂	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CH=CCl ₂	CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CH=CCl ₂	C (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CH=CCl ₂	C (O) CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CH=CCl ₂	C (O) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	CH ₂ C≡CH	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C≡CH	CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C≡CH	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C≡CH	C (O) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C≡CH	C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	CH ₂ C≡CCl	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C≡CCl	CHO	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C≡CCl	C (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C≡CCl	C (O) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C≡CCl	C (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	CH ₂ Ph	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ Ph	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ Ph	CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

193

	CH ₂ Ph	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ Ph	C (O) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ Ph	C (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ Ph	C (O) CH ₃	CH ₃	O (L-45d)	H
5	CH ₂ Ph	C (O) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ Ph	C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ (L-1a)	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CHO	n-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CHO	i-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	CHO	s-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CHO	c-Pen	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₃	n-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₃	n-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₃	c-Pen	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	C (O) CH ₃	c-Pen	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₃	c-Pen	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₃	c-Pen	CH ₃	O (L-45d)	H
	C (O) CH ₃	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Et	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	C (O) Et	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Et	n-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Pr-n	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Pr-i	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Pr-c	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
25	C (O) Bu-n	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Bu-n	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Bu-n	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Bu-n	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Bu-i	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	C (O) Bu-i	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Bu-i	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Bu-i	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Bu-s	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Bu-s	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	C (O) Bu-s	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Bu-s	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Bu-c	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Bu-c	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Bu-c	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	C (O) Bu-c	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ Pr-c	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ Pr-c	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ Pr-c	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Pen-n	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	C (O) Pen-n	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Pen-c	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Pen-c	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

194

	C (O) Pen-c	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) Hex-n	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Hex-n	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) Hex-c	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	C (O) Hex-c	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) Hex-c	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ Pen-c	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ Pen-c	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ F	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	C (O) CH ₂ F	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ F	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ Cl	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	C (O) CH ₂ Cl	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ Cl	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CHF ₂	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CHF ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₃	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
25	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCBr	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
	C (O) CHF ₂	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	C (O) CHF ₂	Et	Et	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CHF ₂	Et	OCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CHF ₂	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	C (O) CHCl ₂	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CHCl ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CHCl ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CHCl ₂	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CCl ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	C (O) CCl ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CCl ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CF ₂ Br	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CF ₂ Br	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CF ₂ Br	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CF ₂ Br	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	C (O) CF ₂ Br	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CF ₂ Br	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	C (O) CF ₂ Br	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

195

	C (O) CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ Cl	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CHClCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CHClCH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	C (O) CH ₂ CH ₂ Br	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ Br	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ CF ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	C (O) CH ₂ CF ₃	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CF ₂ CHF ₂	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CF ₂ CHF ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CF ₂ CHF ₂	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CF ₂ CHF ₂	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	C (O) C ₂ F ₅	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C ₂ F ₅	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) C ₂ F ₅	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) C ₂ F ₅	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CF ₂ CF ₂ Cl	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	C (O) CF ₂ CF ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CF ₂ CF ₂ Cl	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) C (CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
25	C (O) CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ CF ₂ Br	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C ₃ F ₇	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) C ₃ F ₇	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) C ₃ F ₇	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	C (O) CH ₂ CH (CH ₃) CF ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ CH (CF ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (T-1)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (T-4)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	C (O) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
40	C (O) CH ₂ OCH ₃	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ OEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ OEt	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ OEt	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH (CH ₃) OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	C (O) CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ OC (O) CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

196

	C (O) CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	C (O) CH ₂ SCH ₃	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ SO ₂ CH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ SEt	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	C (O) CH ₂ SEt	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ CN	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ CN	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	C (O) CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ C (O) OEt	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH=CH ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH=CHCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	C (O) CH=CHCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (CH ₃)=CH ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH=CHCH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C≡CH	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
25	C (O) C≡CH	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) C≡CH	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ C≡CCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) C≡CCl	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	C (O) CH ₂ C≡CCl	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ (M-9c)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ Ph	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ (L-14a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	C (O) CH ₂ (L-24a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ (L-36a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ (L-45a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) CH ₂ (L-46a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ (L-47a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	C (O) C (O) OCH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (O) OCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) C (O) OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (O) OCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (O) OCH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	C (O) C (O) OCH ₃	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) C (O) OEt	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (O) OEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

197

	C (O) C (O) OEt	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (O) OEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (M-4a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (M-5a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	C (O) (M-8a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OPr-n	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OPr-n	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OPr-i	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OPr-i	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	C (O) OPr-c	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OPr-c	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OBU-n	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OBU-s	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OBU-i	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	C (O) OBU-t	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OPen-n	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ CF ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH ₂ CCl ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	C (O) OCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	C (O) OCH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ C (CH ₃) =CH ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH (CH ₃) CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH ₂ CH=C (CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ C (CH ₃) =CHCH ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	C (O) OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH ₂ CH (CH ₃) CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ CH ₂ C (CH ₃) =CH ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ CCl=CH ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH ₂ CH=CHBr	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	C (O) OCH ₂ CCl=CCl ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ CH=CClCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH ₂ C (CH ₃) =CHBr	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ CH=CHCF ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ CH=CHCF ₂ Br	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	C (O) OCH ₂ CH=CClCF ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ CH ₂ CBr=CH ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH ₂ C≡CCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ C≡CEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	C (O) OCH (CH ₃) C≡CH	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) OCH (CH ₃) C≡CCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OCH ₂ CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

198

	C (O) OCH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) O (M-5a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) O (M-9a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) O (M-9c)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	C (O) OCH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) OPh	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OPh	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) SCH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) SCH ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₃	H
15	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
20	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) SCH ₃	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	C (O) SCH ₃	Et	Et	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) SCH ₃	Et	OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) SEt	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
25	C (O) SEt	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	OCF ₃	H
30	C (O) SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFBBr	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	C (O) SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
35	C (O) SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) SPr-n	Et	CH ₃	O (L-45d)	H
	C (O) SPr-n	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) SCH ₂ CF ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) SCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	C (O) SCH ₂ CH=CH ₂	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) SCH ₂ C (CH ₃)=CH ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) S (M-9c)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) SPh	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) SPh	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	C (O) N (CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) N (CH ₃) ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) N (CH ₃) OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
			CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

199

	C (O) N (CH ₃) OCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-F)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-F)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-F)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	C (O) (Ph-2-Cl)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-2-Cl)	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-Cl)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-3-Cl)	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-4-Cl)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	C (O) (Ph-4-Cl)	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-2-Br)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-Br)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-Br)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-I)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	C (O) (Ph-3-I)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-I)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-CH ₃)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-CH ₃)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-CH ₃)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	C (O) (Ph-2-Et)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-Et)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-Et)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-CF ₃)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-CF ₃)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
25	C (O) (Ph-4-CF ₃)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-OCH ₃)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-OCH ₃)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-OCH ₃)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-OCHF ₂)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	C (O) (Ph-3-OCHF ₂)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-OCHF ₂)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-OCF ₃)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-OCF ₃)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-OCF ₃)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	C (O) (Ph-2-SCH ₃)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-SCH ₃)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-SCH ₃)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-SO ₂ CH ₃)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-SO ₂ CH ₃)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	C (O) (Ph-4-SO ₂ CH ₃)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-SCHF ₂)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-SCHF ₂)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-SCHF ₂)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-SCF ₃)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
45	C (O) (Ph-3-SCF ₃)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-SCF ₃)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-NO ₂)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

200

	C (O) (Ph-3-NO ₂)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (Ph-4-NO ₂)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (Ph-2-CN)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-CN)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	C (O) (Ph-4-CN)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (L-1a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (L-2a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (L-3a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (L-4a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	C (O) (L-16a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (L-17a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (L-20a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (L-22a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (L-23a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	C (O) (L-45a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (L-46a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) (L-47a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (S) OPr-i	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (S) OPr-i	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	C (S) OPen-n	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (S) OPh	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (S) SCH ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (S) SCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (S) SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
25	C (S) SEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (S) SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (S) SCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (S) SCH ₂ C (CH ₃)=CH ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (S) SPh	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	-C (O) C (CH ₃) ₂ CH ₂ -		Br	C (CF ₃) ₂ OH	H
	-C (O) C (CH ₃) ₂ CH ₂ -		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	OH	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	OH	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	OC (O) CH ₃	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SO ₂ CH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SO ₂ CH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SO ₂ CF ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SO ₂ CF ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SO ₂ CF ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	SO ₂ CF ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SCCl ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SCCl ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H

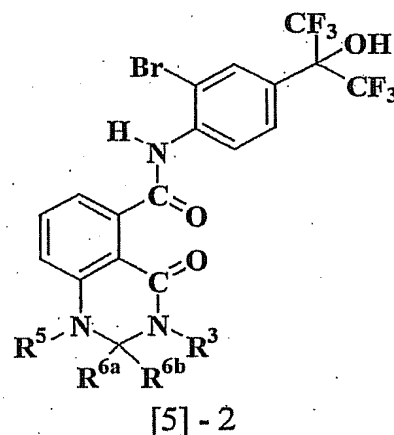
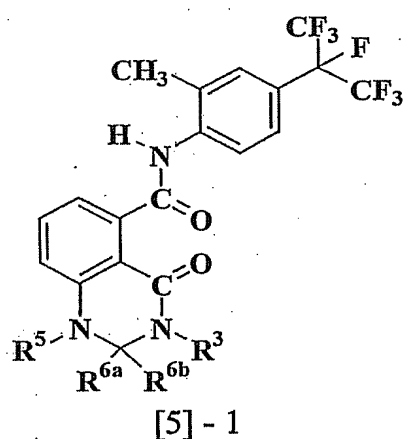
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

201

	SCCl ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SCCl ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SCCl ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SCCl ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	SPh	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SNEt ₂	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SN (Pr-i) ₂	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (Bu-n) ₂	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Bu-n) ₂	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
10	SN (Bu-n) ₂	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	T-16	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	T-17	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	T-18	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	T-18	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
15	T-18	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	T-23	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SN (CH ₃) C (O) OEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (CH ₃) C (O) OPr-n	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (CH ₃) C (O) OBU-n	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	SN (CH ₃) C (O) OBU-n	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SN (CH ₃) C (O) OBU-n	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (CH ₃) C (O) OHex-n	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (Et) C (O) OEt	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Et) C (O) OPr-n	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
25	SN (Et) C (O) OBU-n	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (Pr-i) C (O) OEt	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Pr-i) C (O) OPr-n	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SN (Pr-i) C (O) OBU-n	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

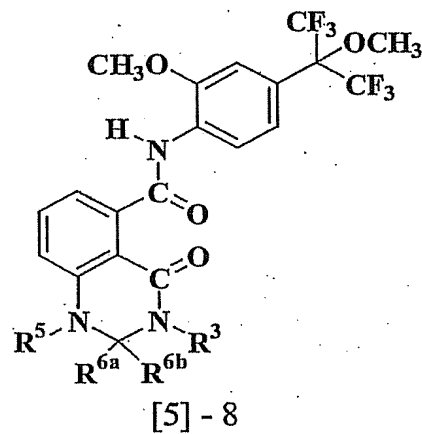
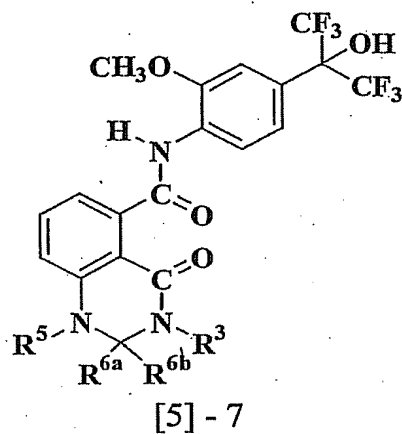
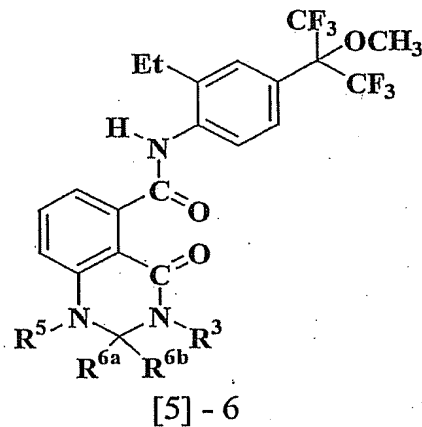
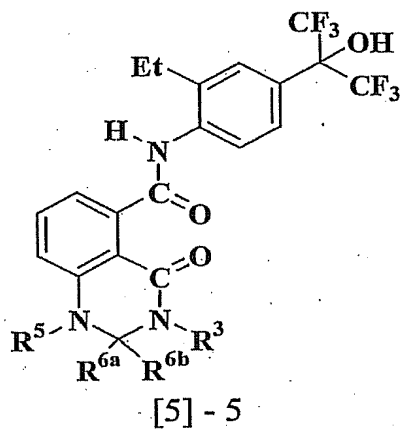
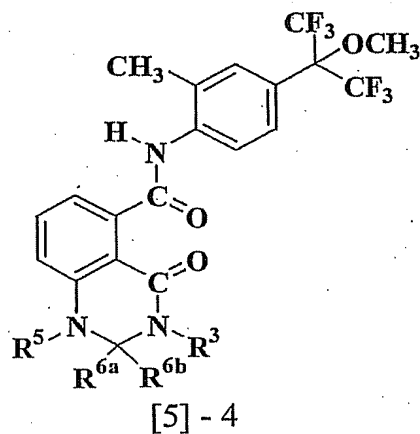
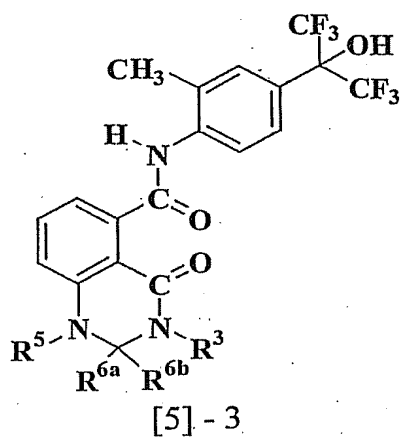
30 第5表



WO 03/011028

PCT/JP02/07833

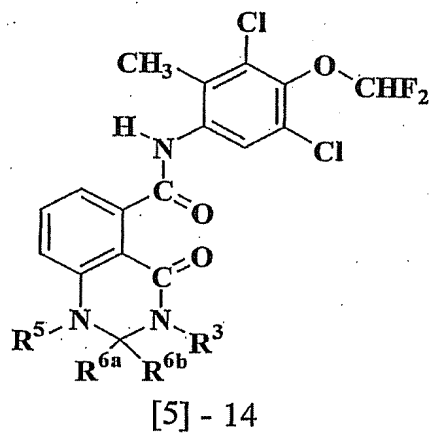
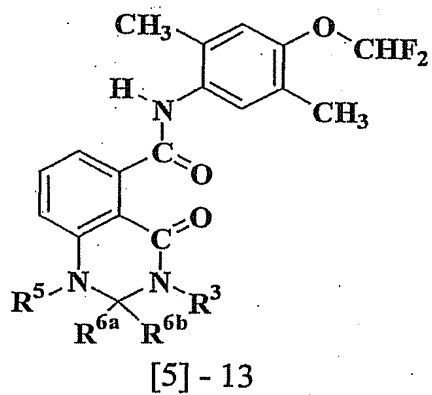
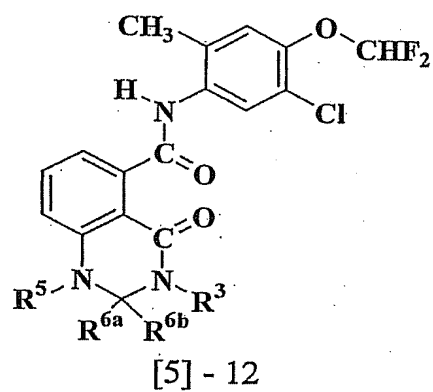
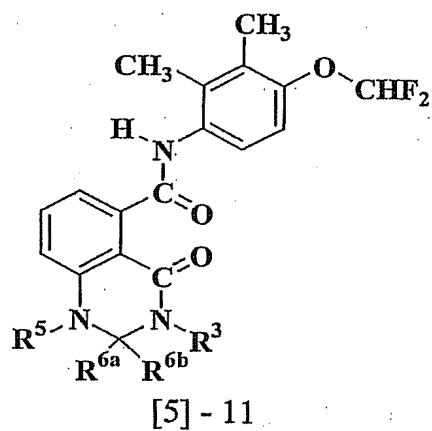
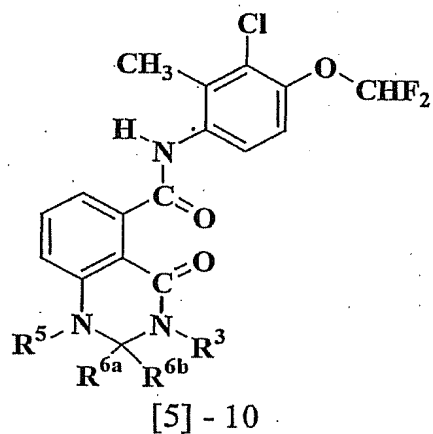
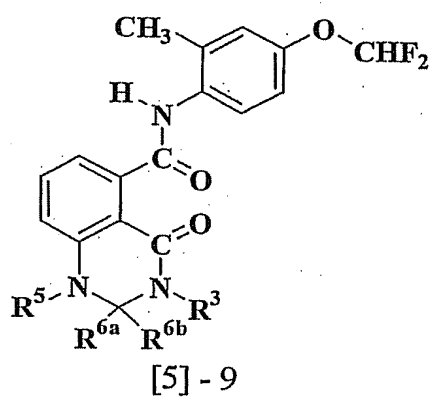
202



WO 03/011028

203

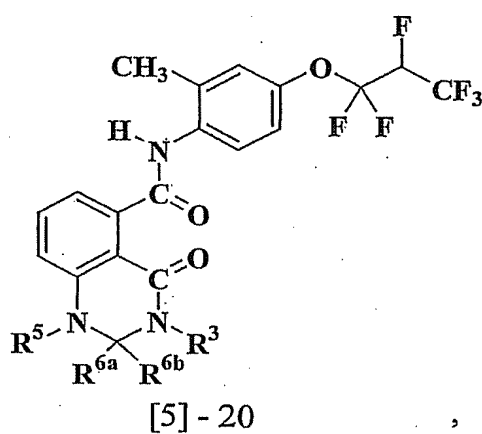
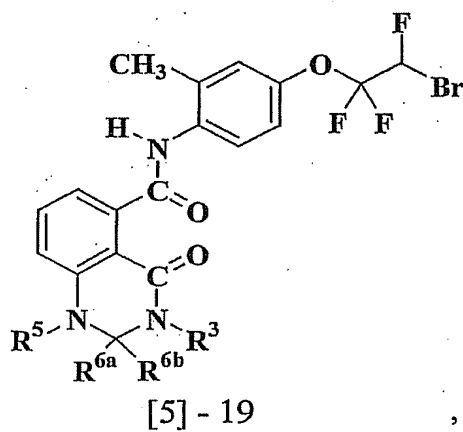
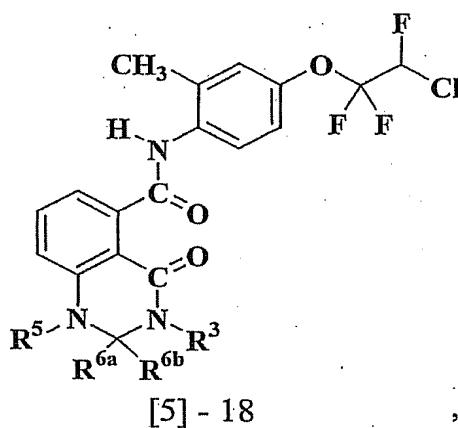
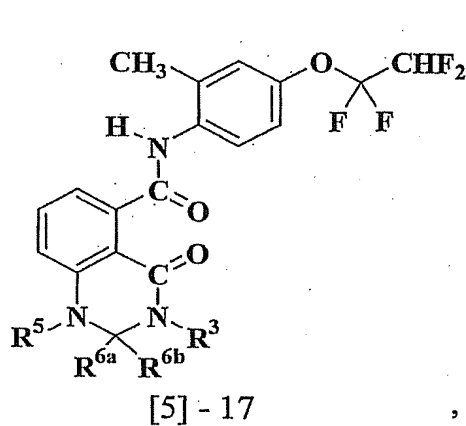
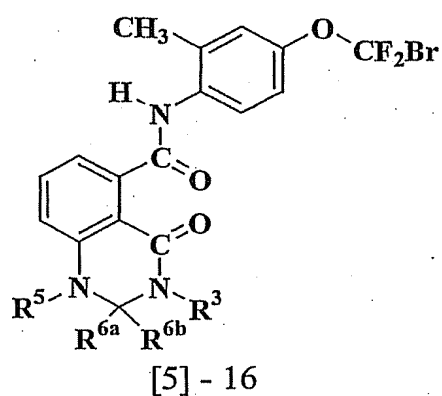
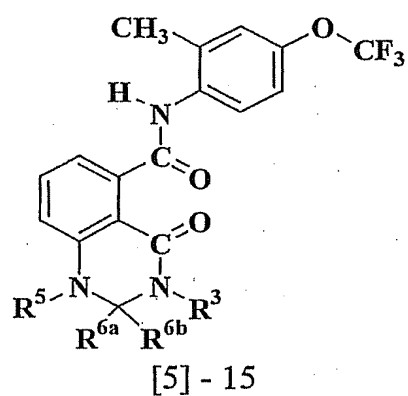
PCT/JP02/07833



WO 03/011028

PCT/JP02/07833

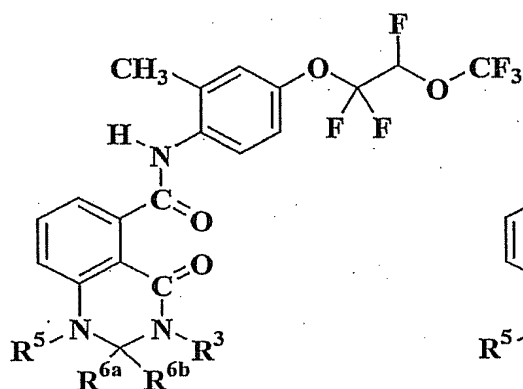
204



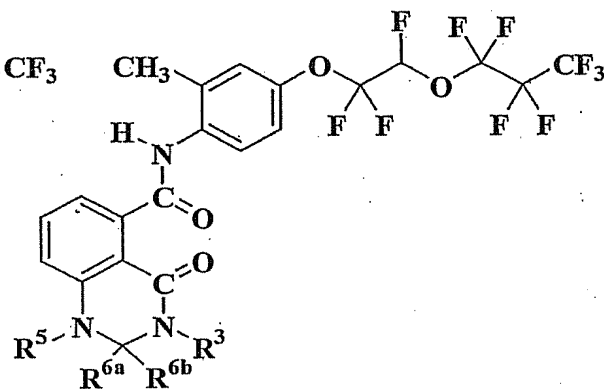
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

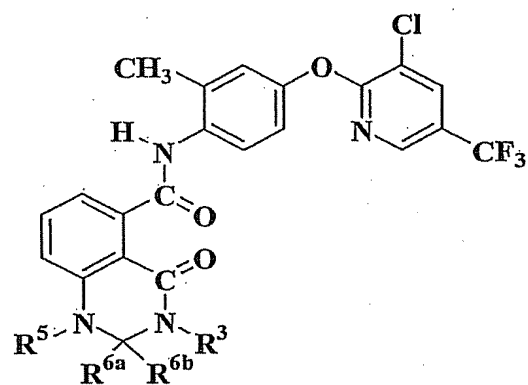
205



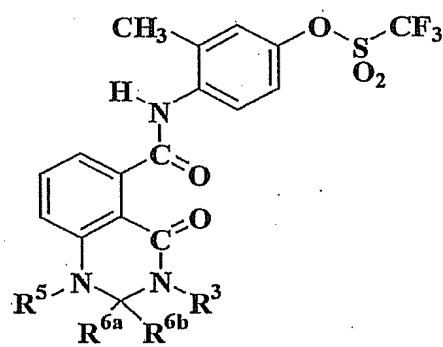
[5] - 21



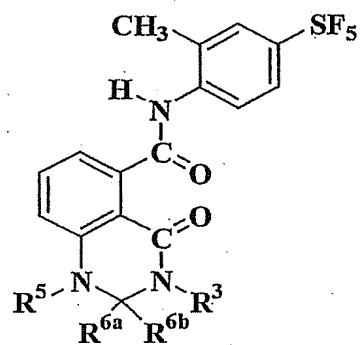
[5] - 22



[5] - 23

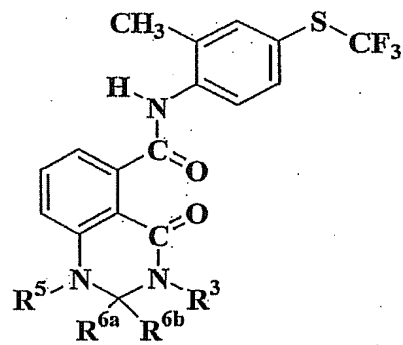


[5] - 24



[5] - 25

または



[5] - 26

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

206

	R ⁵	R ^{6a}	R ^{6b}	R ³
	H	H	H	i-Pr
5	CH ₃	CH ₃	H	Et
	CH ₃	CH ₃	H	n-Pr
	CH ₃	CH ₃	H	i-Pr
	CH ₃	CH ₃	H	c-Pr
	CH ₃	CH ₃	H	s-Bu
10	CH ₃	CH ₃	H	t-Bu
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ Et
	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NH ₂ Et
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
15	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NH ₂ Et
	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ Et
20	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et
25	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CHO
	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH=NOCH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH=NOH
30	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CN
	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH
	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ Ph
35	CH ₃	CH ₃	CH ₃	i-Pr
	CH ₃	Et	H	i-Pr
	CH ₃	Et	CH ₃	i-Pr
	CH ₃	n-Pr	H	i-Pr
	CH ₃	i-Pr	H	i-Pr
40	CH ₃	c-Pr	H	i-Pr
	CH ₃	n-Bu	H	i-Pr
	CH ₃	i-Bu	H	i-Pr
	CH ₃	s-Bu	H	i-Pr
	CH ₃	c-Bu	H	i-Pr
45	CH ₃	n-Pen	H	i-Pr
	CH ₃	c-Pen	H	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	H	i-Pr

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

208

5	Et	Et	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	Et	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
10	Et	Et	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt
15	Et	Et	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	Et	H	CH ₂ C≡CH
20	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	Et	Et	H	CH ₂ Ph
	Et	Et	CH ₃	i-Pr
	Et	Et	CF ₃	i-Pr
	Et	n-Pr	H	i-Pr
25	Et	i-Pr	H	i-Pr
	Et	c-Pr	H	i-Pr
	Et	CH ₂ CH ₂ Cl	H	i-Pr
	Et	CF ₃	H	i-Pr
	Et	CH ₂ CF ₃	H	i-Pr
30	Et	CH ₂ OCH ₃	H	i-Pr
	Et	CH ₂ OPh	H	i-Pr
	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	i-Pr
	Et	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	i-Pr
	Et	CH ₂ SEt	CH ₃	i-Pr
35	Et	C (O) OCH ₃	H	i-Pr
	Et	C (O) OCH ₃	H	s-Bu
	Et	C (O) OCH ₃	H	t-Bu
	Et	C (O) OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHEt
40	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	C (O) OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
45	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt
	Et	C (O) OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

209

	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	C (O) OCH ₃	H	CH ₂ C≡CH
	Et	C (O) OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	Et	C (O) OEt	H	i-Pr
5	Et	C (O) OEt	H	c-Pr
	Et	C (O) OEt	H	s-Bu
	Et	C (O) OEt	H	t-Bu
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ Et
	Et	C (O) OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
10	Et	C (O) OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	C (O) OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
15	Et	C (O) OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	C (O) OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ SEt
	Et	C (O) OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Et
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
20	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CHO
25	Et	C (O) OEt	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	C (O) OEt	H	CH ₂ C≡CH
30	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	Et	C (O) OEt	H	CH ₂ Ph
	Et	CH=CH ₂	H	i-Pr
	Et	OCH ₃	H	i-Pr
	Et	OCH ₃	H	c-Pr
35	Et	OCH ₃	H	s-Bu
	Et	OCH ₃	H	t-Bu
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ Et
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHEt
40	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
45	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SEt
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Et
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

210

	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃
5	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CHO
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
10	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	OCH ₃	H	CH ₂ C≡CH
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	Et	OCH ₃	H	CH ₂ Ph
	Et	OEt	H	i-Pr
15	Et	OEt	H	s-Bu
	Et	OEt	H	t-Bu
	Et	OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
20	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
	Et	OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
25	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt
	Et	OEt	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
30	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	OEt	H	CH ₂ C≡CH
	Et	OEt	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	Et	OPr-n	H	i-Pr
35	Et	OPr-n	H	s-Bu
	Et	OPr-n	H	t-Bu
	Et	OPr-n	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	OPr-n	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
40	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHEt
	Et	OPr-n	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
	Et	OPr-n	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
45	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

211

	Et	OPr-n	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CN
5	Et	OPr-n	H	CH ₂ C≡CH
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	n-Pr	CH ₃	H	i-Pr
	n-Pr	CH ₃	CH ₃	i-Pr
	n-Pr	OCH ₃	H	i-Pr
10	n-Pr	OEt	H	i-Pr
	n-Pr	OPr-n	H	i-Pr
	i-Pr	CH ₃	H	i-Pr
	i-Pr	CH ₃	CH ₃	i-Pr
	i-Pr	OCH ₃	H	i-Pr
15	i-Pr	OEt	H	i-Pr
	i-Pr	OPr-n	H	i-Pr
	n-Bu	CH ₃	H	i-Pr
	n-Bu	CH ₃	CH ₃	i-Pr
	n-Bu	OCH ₃	H	i-Pr
20	n-Bu	OEt	H	i-Pr
	n-Bu	OPr-n	H	i-Pr
	i-Bu	H	H	i-Pr
	s-Bu	H	H	i-Pr
	CH ₂ Pr-c	H	H	i-Pr
25	CH ₂ CF ₃	H	H	i-Pr
	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	i-Pr
	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	i-Pr
	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	i-Pr
	CH ₂ C (O) OCH ₃	H	H	i-Pr
30	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	H	i-Pr
	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	H	H	i-Pr
	CH ₂ Ph	H	H	i-Pr
	CHO	H	H	i-Pr
	C (O) CH ₃	H	H	i-Pr
35	C (O) Et	H	H	i-Pr
	C (O) CH ₂ F	H	H	i-Pr
	C (O) CH ₂ Cl	H	H	i-Pr
	C (O) CH ₂ OCH ₃	H	H	i-Pr
	C (O) CH ₂ SCH ₃	H	H	i-Pr
40	C (O) Ph	H	H	i-Pr
	C (O) OCH ₃	H	H	i-Pr
	C (O) OEt	H	H	i-Pr
	C (O) SCH ₃	H	H	i-Pr
	C (O) SEt	H	H	i-Pr
45	C (O) NHCH ₃	H	H	i-Pr
	C (O) N (CH ₃) ₂	H	H	i-Pr
	C (S) SCH ₃	H	H	i-Pr

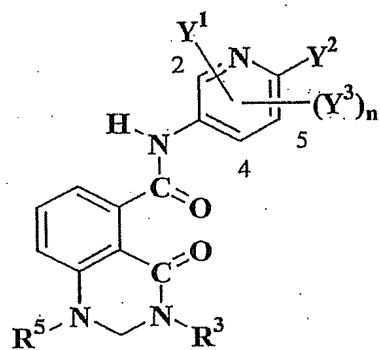
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

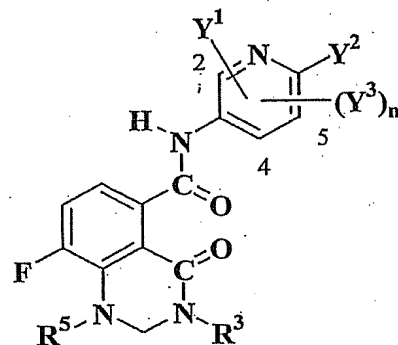
212

C(S) SEt	H	H	i-Pr
SO ₂ CH ₃	H	H	i-Pr

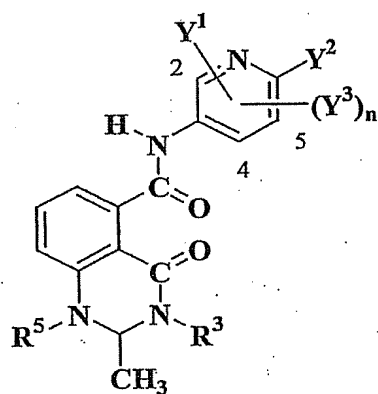
5 第6表



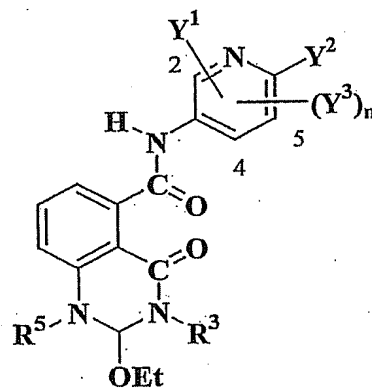
[6] - 1



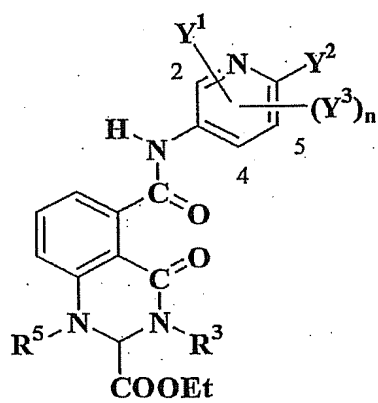
[6] - 2



[6] - 3

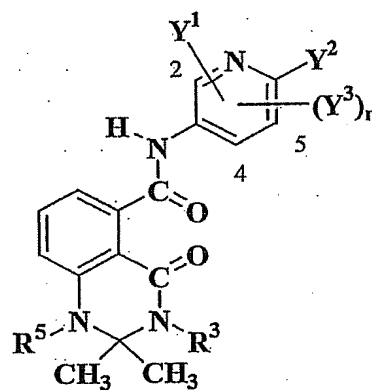


[6] - 4



[6] - 5

または



[6] - 6

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

213

	R ⁵	R ³	Y ²	Y ¹ , (Y ³) _n
5	CH ₃	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₃	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	CH ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	Et	Et	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	n-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	i-Pr	H	4-SP _T -i
	Et	i-Pr	H	4-SBu-i
	Et	i-Pr	Cl	4-CH ₃
15	Et	i-Pr	CH ₃	2-OCH (CF ₃) ₂
	Et	i-Pr	CF ₂ CF ₃	2-Cl
	Et	i-Pr	CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	H
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-Cl
20	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-OCH ₃
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-SCH ₃
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ Br	2-CH ₃
25	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFCI	2-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFCI	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFB _r	2-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFB _r	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFCF ₃	2-CH ₃
30	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFCF ₃	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	H
	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-Cl
	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-OCH ₃
35	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₃	2-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₃	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-Cl
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
40	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	4-CH ₃
	Et	i-Pr	O (Ph-4-Br)	4-CH ₃
	Et	i-Pr	O (Ph-4-CF ₃)	2-CH ₃
	Et	i-Pr	O (Ph-2, 4-Cl ₂)	H
	Et	i-Pr	O (Ph-2-Cl-4-CF ₃)	2-CH ₃
45	Et	i-Pr	O (L-45b)	2-CH ₃
	Et	i-Pr	O (L-45c)	2-CH ₃
	Et	i-Pr	O (L-45d)	2-CH ₃
	Et	i-Pr	O (L-45d)	4-CH ₃

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

214

	Et	i-Pr	SCHF ₂	2-CH ₃
	Et	i-Pr	N(CH ₃) C(O) CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	c-Pr	CH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	c-Pr	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
5	Et	s-Bu	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	s-Bu	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	t-Bu	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	t-Bu	CF(CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	t-Bu	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	Et	t-Bu	OCH(CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	t-Bu	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ Et	CH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ Et	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
15	Et	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	4-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NHCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
20	Et	CH(CH ₃)CH ₂ OC(O)NH ₂ t	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	4-CH ₃
25	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CH(CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	4-CH ₃
30	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	4-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NH ₂ t	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CH ₃
35	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCF ₂ CHFCI	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCF ₂ CHFBr	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	4-CH ₃
40	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
45	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ Et	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

215

5	Et	$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	$CF(CF_3)_2$	4- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	4- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	$OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH_2SEt$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH_2SO_2Et$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH_2NHC(O)OCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
10	Et	$C(CH_3)_2CH_2NHC(O)OEt$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CHO$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$CH(CH_3)CH=NOCH_3$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH=NOH$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
15	Et	$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	$CF(CF_3)_2$	4- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	4- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	$OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2CN$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
20	Et	$CH_2C\equiv CH$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	$C(CH_3)_2C\equiv CH$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	Et	CH_2Ph	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	n-Pr	i-Pr	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	i-Pr	i-Pr	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
25	n-Bu	i-Pr	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	i-Bu	i-Pr	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	s-Bu	i-Pr	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	i-Pr	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	s-Bu	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	t-Bu	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
30	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2Et$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$CH(CH_3)CH_2OCH_3$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2CH_2OC(O)NHCH_3$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$CH(CH_3)CH_2SCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
35	CH_2OCH_3	$CH(CH_3)CH_2SO_2CH_3$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2CN$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
40	CH_2OCH_3	$CH_2C\equiv CH$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OCH_3	$C(CH_3)_2C\equiv CH$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OEt	i-Pr	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OEt	s-Bu	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OEt	t-Bu	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
45	CH_2OEt	$C(CH_3)_2Et$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OEt	$CH(CH_3)CH_2OCH_3$	$OCH(CF_3)_2$	2- CH_3
	CH_2OEt	$CH(CH_3)CH_2OC(O)NHEt$	$CF(CF_3)_2$	2- CH_3

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

216

	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC(O)NHt	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
5	CH ₂ OEt	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH(CH ₃)CH ₂ SEt	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ Et	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHC(O)OEt	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
15	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CHO	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH(CH ₃)CH=NOCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CN	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH ₂ C≡CH	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
20	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ C≡CH	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	i-Pr	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	t-Bu	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
25	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
30	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₂ C≡CH	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(CH ₃)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CH	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	i-Pr	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	t-Bu	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
35	CH(Et)OCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
40	CH(Et)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	C(CH ₃) ₂ C≡CH	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
15	CH ₂ C≡CH	i-Pr	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH	s-Bu	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH	t-Bu	OCH(CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH	C(CH ₃) ₂ Et	CF(CF ₃) ₂	2-CH ₃

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

217

	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{NHCH}_3$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
5	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}=\text{NOCH}_3$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
10	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	CHO	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{Et}$	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
15	$\text{C}(\text{O})\text{Pr-n}$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{Pr-i}$	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{Pr-c}$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{Bu-t}$	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{CHF}_2$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
20	$\text{C}(\text{O})\text{CF}_3$	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{CF}_2\text{Cl}$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	Ph	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{OEt}$	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
25	$\text{C}(\text{O})\text{OPr-n}$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{OPr-i}$	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
	$\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CF}_3$	$i\text{-Pr}$	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3
30	SCCl_3	$i\text{-Pr}$	$\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$	2-CH_3

本発明化合物は、農園芸作物及び樹木などを加害する所謂農業害虫、家畜、家禽類に寄生する所謂家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影響を与える所謂衛生害虫、倉庫に貯蔵された穀物等を加害する所謂貯穀害虫、及び同様の場面で発生、加害するダニ類、線虫類、軟体動物、甲殻類の何れの害虫も低濃度で有効に防除できる。

35 本発明化合物を用いて防除しうる昆虫類、ダニ類、線虫類、軟体動物及び甲殻類には具体的に、例えば、

コナガ (*Plutella xylostella*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、カブラヤガ (*Agrotis segetum*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、タバコガ (*Helicoverpa assulta*)、コットンボールワーム (*Helicoverpa zea*)、タバコバッドワーム (*Heliothis virescens*)、
 40 ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、フタオビコヤガ (*Naranga aenescens*)、タマナギンウワバ (*Plusia nigrisigna*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、シロイチモジヨトウ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

218

- (*Spodoptera exigua*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、コットンリーフワーム (*Spodoptera littoralis*)、フォールアーミーワーム (*Spodoptera frugiperda*)、サザンアーミーワーム (*Spodoptera eridania*)、トマトホーンワーム (*Manduca quinquemaculata*)、タバコホーンワーム (*Manduca sexta*)、グレープベリーモス
- 5 (*Endopiza viteana*)、ギンモンハモグリガ (*Lyonetia prunifoliella malinella*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoneella*)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana faciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnamina*)、コドリリング (*Cydia pomonella*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、ヨーロピアンコーンボーラー (*Ostrinia nubilalis*)、ソイビーンルーパー (*Pseudoplusia includens*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、イチモンジセセリ (*Parnara guttata*) 等の鱗翅目害虫、
- 10 ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、コロラドポテトビートル (*Lepinotarsa decemlineata*)、インゲンテントウ (*Epilachna varivestis*)、カンシャクシコメツキ (*Melanotus tamsuyensis*)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ヒメヒラタケシキスイ (*Epuraea domina*)、ニ
- 20 ジュウヤホシテントウ (*Henosepilachna vigintioctopunctata*)、チャイロコメノゴミムシ (*Tenebrio molitor*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、マツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、アリモドキ
- 25 ゾウムシ (*Cylas formicarius*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、イネゾウムシ (*Ethinocnemus squameus*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、コクゾウ (*Sitophilus zeamais*)、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus vestius*)、グラナリーウィービル (*Sitophilus granarius*)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata*)、ウエスタンコーンルートワーム

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

219

ム (*Diabrotica virgifera*)、ノーザンコーンルートワーム (*Diabrotica barberi*)、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) 等の鞘翅目害虫、

ナガメ (*Eurydema rugosa*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、クモヘリカメムシ

5 (*Leptocoris chinensis*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、ターニッシュドプラントバグ (*Lygus lineolaris*)、

コットンフリーホッパー (*Psuedatomoscelis seriatus*)、ツツジゲンバイ (*Stephanitis pyrioides*)、フタテンオオヨコバイ (*Epiacanthus stramineus*)、チャノミドリヒメヨコ

バイ (*Empoasca onukii*)、ポテトリーフホッパー (*Empoasca fabae*)、ツマグロヨコバイ

10 (*Nephotettix cincticeps*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイロウン

カ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ

(*Trioza erythrae*)、ナシキジラミ (*Psylla pyrisuga*)、シルバーリーフコナジラミ

(*Bemisia argentifolii*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ

(*Dialeurodes citri*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、ワタアブラ

15 ムシ (*Aphis gossypii*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis pomi*)、モモアカアブラムシ

(*Myzus persicae*)、オオワラジカイガラムシ (*Drosicha corpulenta*)、イセリアカイガラ

ムシ (*Icerya purchasi*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、クワコナカイ

ガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、ヤノネカ

イガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、トコジラミ (*Cimex lectularius*) 等の半翅目害虫、

20 ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ヒラズハナアザミウマ

(*Frankliniella intonsa*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ミナミ

キイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*) 等の総翅目害虫、

ミカンコミバエ (*Dacus dorsalis*)、ウリミバエ (*Dacus cucurbitae*)、チチュウカイミ

バエ (*Ceratitis capitata*)、イネヒメハモグリバエ (*Hydrellia griseola*)、ナスハモグ

25 リバエ (*Liriomyza bryoniae*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、タネバエ

(*Hylemya platura*)、アップルマゴット (*Rhagoletis pomonella*)、ヘシアンフライ

(*Mayetiola destructor*)、イエバエ (*Musca domestica*)、サシバエ (*Stomoxys*

calcitrans)、ヒツジシラミバエ (*Melophagus ovinus*)、ウシバエ (*Hypoderma bovis*)、キ

スジウシバエ (*Hypoderma lineatum*)、ヒツジバエ (*Oestrus ovis*)、ツエツエバエ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

220

- (*Glossina palpalis*, *Glossina morsitans*)、キアシオオブユ (*Prosimulium yezoensis*)、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、オオチョウバエ (*Telmatoscopus albipunctatus*)、トクナガヌカカ (*Leptoconops nipponensis*)、アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、ネツタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、シナハマダラカ
- 5 (*Anopheles hyrakanus sinesis*) 等の双翅目害虫、
- クリハバチ (*Apethymus kuri*)、カブラハバチ (*Athalia rosae japonensis*)、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*)、グンタイアリ (*Eciton burchelli*, *Eciton schmitti*)、クロオオアリ (*Camponotus japonicus*)、オオスズメバチ (*Vespa mandarina*)、ブルドックアント (*Myrmecia* spp.)、ファイヤーアント類 (*Solenopsis* spp.)、ファラオアント
- 10 (*Monomorium pharaonis*) 等の膜翅目害虫、
- クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 等の網翅目害虫、
- エンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)、ケラ (*Gryllotalpa africana*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、サバクワタリバッタ
- 15 (*Schistocerca gregaria*) 等の直翅目害虫、
- イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*) 等のシロアリ目害虫、
- ネコノミ (*Ctenocephalidae felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) 等の等翅目害虫、
- 20 ニワトリオオハジラミ (*Menacanthus stramineus*)、ウシハジラミ (*Bovicola bovis*) 等のハジラミ目害虫、
- ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、ケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) 等のシラミ目害虫、
- 25 ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) 等のハダニ類、
- チャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、チューリップサビダニ (*Aceria tulipae*) 等のフシダニ類、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

221

チャノホコリダニ (*Polyphao tarsonemus latus*)、シクラメンホコリダニ (*Steneotarsonemus pallidus*) 等のホコリダニ類、

ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ロビンネダニ (*Rhizoglyphus robini*) 等のコナダニ類、

5 ミツバチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*) 等のハチダニ類、

オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*) 等のマダニ類、

ヒツジキュウセンダニ (*Psoroptes ovis*) 等のキュウセンダニ類、

ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*) 等のヒゼンダニ類、

10 オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*) 等の甲殻類、

キタネグサレセンチュウ (*Prathylenchus penetrans*)、クルミネグサレセンチュウ

(*Prathylenchus vulnus*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ダ

イズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne*

hapla)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、マツノザイセンチュウ

15 (*Bursaphelenchus lignicolus*) 等の線虫類、

スクミリンゴガイ (*Ponacea canaliculata*)、ナメクジ (*Incilaria bilineata*)、ウスカワマイマイ (*Acusta despecta sieboldiana*)、ミスジマイマイ (*Euhadra peliomphala*) 等の軟体動物、

等が挙げられるが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

20 さらに、本発明化合物は、有機燐系化合物、カーバメート系化合物又はピレスロイド系化合物等の既存の殺虫剤に対して抵抗性の発達した害虫に対しても有効である。

すなわち、本発明化合物は、直翅目、アザミウマ目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅目、双翅目、網翅目、等翅目、シロアリ目、ダニ・シラミ類及び線虫類の害虫を低濃度で有効に防除することが出来る。一方、本発明化合物はホ乳類、魚類、甲殻類及び益虫

25 に対してほとんど悪影響の無い極めて有用な特長を有している。

本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤および分解防止剤等を添加して、液剤 (soluble concentrate)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、水和剤 (wetttable powder)、水

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

222

溶剤 (water soluble powder)、顆粒水和剤 (water dispersible granule)、顆粒水溶剤 (water soluble granule)、懸濁剤 (suspension concentrate)、乳濁剤 (emulsion, oil in water)、サスポエマルジョン (suspoemulsion)、マイクロエマルジョン (microemulsion)、粉剤 (dustable powder)、粒剤 (granule) およびゲル剤 (gel)

- 5 等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を、水溶性カプセルおよび水溶性フィルムの袋等の水溶性包装体に封入して供することもできる。

- 10 固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成シリカならびに合成シリケートが挙げられる。

- 15 液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、 γ -ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドンおよびN-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

- 20 界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸およびリン酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸およびリン酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならび
- 25

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

223

にアミノ酸型およびベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05～20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

- 5 本発明化合物の施用葉量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異は有るが、一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり0.005～50kg程度が適当である。

- 次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。
- 10

〔水和剤〕

- | | |
|--------|---------|
| 本発明化合物 | 0.1～80部 |
| 固体担体 | 5～98.9部 |
| 界面活性剤 | 1～10部 |
| 15 その他 | 0～5部 |

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

〔乳剤〕

- | | |
|----------|----------|
| 本発明化合物 | 0.1～30部 |
| 液体担体 | 4.5～9.5部 |
| 20 界面活性剤 | 4.9～1.5部 |
| その他 | 0～1.0部 |

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔懸濁剤〕

- | | |
|---------|------------|
| 本発明化合物 | 0.1～70部 |
| 25 液体担体 | 1.5～98.89部 |
| 界面活性剤 | 1～1.2部 |
| その他 | 0.01～30部 |

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

〔顆粒水和剤〕

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

224

本発明化合物	0.1～90部
固体担体	0～98.9部
界面活性剤	1～20部
その他	0～10部

- 5 その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔液 剤〕

本発明化合物	0.01～70部
液体担体	20～99.99部
その他	0～10部

- 10 その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

〔粒 剤〕

本発明化合物	0.01～80部
固体担体	10～99.99部
その他	0～10部

- 15 その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔粉 剤〕

本発明化合物	0.01～30部
固体担体	65～99.99部
その他	0～5部

- 20 その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

次に、本発明化合物を有効成分とする製剤例をより具体的に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、以下の配合例において、「部」は重量部を意味する。

〔配合例1〕水和剤

25 本発明化合物No. 1-068	20部
パイロフィライト	74部
ソルボール5039	4部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

225

カープレックス#80D 2部

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

〔配合例2〕乳剤

5 本発明化合物 No. 1-068 5部

キシレン 7.5部

N-メチルピロリドン 1.5部

ソルボール2680 5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品

10 名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

〔配合例3〕懸濁剤

本発明化合物 No. 1-068 2.5部

アグリゾールS-710 1.0部

15 (非イオン性界面活性剤：花王(株)商品名)

ルノックス1000C 0.5部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

キサンタンガム 0.2部

水 64.3部

20 以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

〔配合例4〕顆粒水和剤

本発明化合物 No. 1-068 7.5部

ハイテノールNE-15 5部

(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬(株)商品名)

25 バニレックスN 1.0部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙(株)商品名)

カープレックス#80D 1.0部

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

226

乾燥して顆粒水和剤とする。

〔配合例 5〕 粒 剤

本発明化合物 No. 1-0 6 8	5 部
ベントナイト	5 0 部
5 タルク	4 5 部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

〔配合例 6〕 粉 剤

本発明化合物 No. 1-0 6 8	3 部
10 カープレックス # 8 0 D	0. 5 部
(合成含水珪酸：塩野義製薬 (株) 商品名)	
カオリナイト	9 5 部
リン酸ジイソプロピル	1. 5 部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

- 15 使用に際しては、上記製剤を水で 1 ~ 1 0 0 0 0 倍に希釈して、又は希釈せずに直接散布する。

また、本発明化合物を農薬として使用する場合には、必要に応じて製剤時又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤等と混合施用しても良い。

- 20 特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の低減による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大やより高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えばファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook) 1 9 9 9 年版に記載されている化合物等が挙げら
- 25 れる。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみに限定されるものではない。

殺菌剤：アシベンゾラルー S - メチル (acibenzolar-S-methyl)、アシルアミノベンザミド (acylaminobenzamide)、アンバム (amobam)、アムプロピルホス (ampropyfos)、アニラジン (anilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アゾキシストロビン

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

227

(azoxystrobin)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ベンチアゾール (benthiazole)、ベンザマクリル (benzamacril)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ピテルタノール (bitertanol)、ベトキサジン (bethoxazine)、ボルドー液 (bordeaux mixture)、プラストサイジン-S (blasticidin-S)、プロモコナゾール (bromoconazole)、ブピリメート (bupirimate)、ブチオベート (buthiobate)、カルシウムポリスルフィド (calcium polysulfide)、キャプタフォル (captafol)、キャプタン (captan)、銅オキシクロリド (copper oxychloride)、カルプロパミド (carpropamid)、カルベンダジン (carbendazim)、カルボキシシン (carboxin)、CGA-279202 (試験名)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロベンチアゾン (chlobenthiazole)、クロルフエナゾール (chlorfenazol)、クロロネブ (chloroneb)、クロロタロニル (chlorothalonil)、クロゾリネート (chlozolate)、クフラネブ (cufraneb)、シモキサニル (cymoxanil)、シプロコナゾール (cyproconazol)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、ダゾメット (dazomet)、デバカルブ (debacarb)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジクロブトラゾール (diclobutrazol)、ジクロフラニド (diclhlouanid)、ジクロメジン (diclomedine)、ジクロラン (dicloran)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジクロシメット (diclocymet)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジフルメトリン (diflumerim)、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジニコナゾール-M (diniconazole-M)、ジノカップ (dinocap)、ジフェニルアミン (diphenylamine)、ジピリチオン (dipyrithione)、ジタリムホス (ditalimfos)、ジチアノン (dithianon)、ドデモルフ (dodemorph)、ドジン (dodine)、ドラゾクソロン (drazoxolon)、エデフェノホス (edifenphos)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、エチリモール (ethirimol)、エトリジアノール (etridiazole)、ファモキサゾン (famoxadone)、フェナリモール (fenarimol)、フェブコナゾール (febuconazole)、フェナミドン (fenamidone)、フェンダゾスラム (fendazosulam)、フェンフラム (fenfuram)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンチン (fentin)、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

228

- フェルバン (ferbam)、フェリムゾン (ferimzone)、フルアジナム (fluazinam)、フルジオキシニル (fludioxonil)、フルオロイミド (fluoroimide)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアフォール (flutriafol)、
- 5 フォルペット (folpet)、フォセチルーアルミニウム (fosetyl-aluminium)、フベリダゾール (fuberidazole)、フララキシル (furalaxyl)、フラメトピル (furametpyr)、グアザチン (guazatine)、ヘキサクロロベンゼン (hexachlorobenzene)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヒメキサゾール (hymexazol)、イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン (iminocladine)、イブコナ
- 10 ゾール (ipconazole)、イプロベンホス (iprobentfos)、イプロジオン (iprodione)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、カスガマイシン (kasugamycin)、クレソキシムーメチル (kresoxim-methyl)、マンカップパー (mancopper)、マンコゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepconil)、メタラキシル (metaxyl)、メトコナ
- 15 ゾール (metconazole)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メチラム (metiram)、メトミノストロビン (metominostrobin)、ミクロブタニル (myclobutanil)、MTF-753 (試験名)、ナバム (nabam)、ニッケルビス (ジメチルジチオカーバメート) (nickel bis (dimethyldithiocarbamate))、ニトロタールーイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ヌアリモル (nuarimol)、NNF-9425 (試験名)、オクチリノン
- 20 (octhilinone)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、ペフラゾエート (pefurzoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、フタライド (phthalide)、ピペラリン (piperalin)、ポリオキシ (polyoxins)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、プロベナゾール
- 25 (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロバモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキロン (pyroquilon)、キノメチオネート (quinomethionate)、キノキシフェン (quinoxifen)、キントゼン

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

229

(quintozene)、RH7281 (試験名)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、硫黄 (sulfur)、スピロキサミン (spiroxamine)、テブコナゾール (tebuconazole)、テクナゼン (tecnazene)、テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チアジアジン (thiadiazin/milneb)、チフルザミド (thifluzamide)、チオファネートーメチル (thiophanate-methyl)、チラム (thiram)、トルクロホスーメチル (tolclofos-methyl)、トリルフラニド (tolylfluanid)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (toriadimenol)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリホリン (triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、ピンクロゾリン (vinclozolin)、硫酸亜鉛 (zinc sulfate)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram) 及びシイタケ菌糸体抽出物など。

殺バクテリア剤：ストレプトマイシン (streptomycin)、テクロフタラム (tecloftalam)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline) 及びオキシソリニックアシド (oxolinic acid) など。

殺線虫剤：アルドキシカルブ (aldoxycarb)、カズサホス (cadusafos)、フォスチアゼート (fosthiazate)、フォスチエタン (fosthietan)、オキサミル (oxamyl) 及びフェナミホス (fenamiphos) など。

殺ダニ剤：アセキノシル (acequinocyl)、アミトラズ (amitraz)、ビフェナゼート (bifenazate)、プロモプロピレート (bromopropylate)、チノメチオネート (chinomethionat)、クロロベンジラート (chlorobezilate)、クロフェンテジン (clofentezine)、サイヘキサチン (cyhexatine)、ジコフォール (dicofol)、ジエノクロール (dienochlor)、エトキサゾール (etoxazole)、フェナザキン (fenazaquin)、フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンプロキシメート (fenproximate)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ミルベメクチン (milbemectin)、プロパルギット (propargite)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン (pyrimidifen) 及びテブフェンピラド (tebufenpyrad) など。

殺虫剤：アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタミピリド

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

230

- (acetamipirid)、アルディカルブ (aldicarb)、アレスリン (allethrin)、アジンホ
スーメチル (azinphos-methyl)、ベンジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ
(benfuracarb)、ベンスルタップ (bensultap)、ピフェントリン (bifenthrin)、ブ
プロフェジン (buprofezin)、ブトカルボキシム (butocarboxim)、カルバリル
5 (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、カル
タップ (cartap)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、クロルピリホス
(chlorpyrifos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン
(chlorfluazuron)、クロチアニジン (clothianidin)、クロマフェノジド
(chromafenozide)、クロピリホスーメチル (chlorpyrifos-methyl)、シクロプロトリ
10 ン (cycloprothrin)、シフルトリン (cyfluthrin)、ベーターシフルトリン (beta-
cyfluthrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、シロマジン (cyromazine)、シハロ
トリン (cyhalothrin)、ラムダーシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、デルタメトリ
ン (deltamethrin)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ダイアジノン
(diazinon)、ジアクロデン (diaclofen)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジ
15 メチルビンホス (dimethylvinphos)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスルフォトン
(disulfoton)、ジメトエート (dimethoate)、エマメクチンベンゾエート
(emamectin-benzoate)、EPN、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェ
ンカルブ (ethiofencarb)、エチプロール (ethiprole)、エトフェンプロックス
(etofenprox)、エトリムホス (etrimfos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、
20 フェノブカルブ (fenobucarb)、フェノキシカーブ (fenoxycarb)、フェンプロパトリ
ン (fenpropathrin)、フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、
フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェノ
クスウロン (flufenoxuron)、フルフェンプロックス (flufenprox)、タウフルバリ
ネート (tau-fluvalinate)、ホノホス (fonophos)、フォルメタネート
25 (formetanate)、フォルモチオン (formothion)、フラチオカルブ (furathiocarb)、
ハロフェノジド (halofenozide)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヒドラメチル
ノン (hydramethylnon)、イミダクロプリド (imidacloprid)、イソフェンホス
(isofenphos)、インドキサカルブ (indoxacarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、
イソキサチオン (isoxathion)、ルフエヌウロン (lufenuron)、マラチオン

- (malathion)、メタルデヒド (metaldehyde)、メタミドホス (methamidophos)、メチ
 ダチオン (methidathion)、メタクリホス (methacrifos)、メタルカルブ
 (metacarb)、メソミル (methomyl)、メソプレレン (methoprene)、メトキシクロール
 (methoxychlor)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、モノクロトホス
 5 (monocrotophos)、ムスカルーレ (muscalure)、ニジノテフラン (nidinotefuran)、
 ニテンピラム (nitenpyram)、オメトエート (omethoate)、オキシデメトン-メチル
 (oxydemeton-methyl)、オキサミル (oxamyl)、パラチオン (parathion)、パラチオ
 ン-メチル (parathion-methyl)、ペルメトリン (permethrin)、フェントエート
 (phenthoate)、フォキシム (phoxim)、ホレート (phorate)、ホサロン
 10 (phosalone)、ホスメット (phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、ピリミカ
 ルブ (pirimicarb)、ピリミホス-メチル (pirimiphos-methyl)、プロフェノホス
 (profenofos)、プロトリフェンブト (protrifenbute)、ピメトロジン
 (pymetrozine)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリプロキシフェン (pyriproxifen)、
 ロテノン (rotenone)、スルプロホス (sulprofos)、シラフルオフエン
 15 (silaflluofen)、スピノサド (spinosad)、スルホテップ (sulfotep)、テブフェノジ
 ド (tebfenozide)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テフルトリン
 (tefluthorin)、テルブホス (terbufos)、テトラクロロビンホス
 (tetrachlorvinphos)、チアクロプリド (thiacloprid)、チオシクラム
 (thiocyclam)、チオジカルブ (thiodicarb)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チ
 20 オファノックス (thiofanox)、チオメトン (thiometon)、トルフェンピラド
 (tolfenpyrad)、トラロメスリン (tralomethrin)、トリクロルホン (trichlorfon)、
 トリアズロン (triazuron)、トリフルムロン (triflumuron) 及びバミドチオン
 (vamidothion) など。

25 実施例

以下に本発明化合物の合成例、試験例を実施例として具体的に述べることで、本発明
 をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

[合成例]

合成例 1

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

232

N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-(1-メトキシエチリデンアミノ)フタル酸ジアミド(本発明化合物 No. 1-108)。

5 工程1; 3-アミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-(1-メトキシエチリデンアミノ)フタル酸ジアミドの製造。

N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-ニトロフタル酸ジアミド(EP 0,919,542号公報記載の化合物)9.2gのメタノール350ml溶液に、5%活性炭担持パラジウム0.35gを添加し、常圧水素雰囲気下にて3時間攪拌した。反応完結後、不溶物をセライト濾過、減圧下にて溶媒を留去すること
10 により得られた固体をジイソプロピルエーテル-ヘキサン混合溶媒にて洗浄し、目的物7.5gを白色結晶として得た。

融点215.0~216.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.41 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.47 (d, J=9.3Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.2-7.3 (m, 1H), 6.97 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J=8.2, 0.8Hz, 1H), 6.08 (d, J=6.8Hz, 1H), 4.59 (bs, 2H), 4.05-4.2 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.05 (d, J=6.6Hz, 6H).

工程2; N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-(1-メトキシエチリデンアミノ)フタル酸ジアミドの製造。

3-アミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-(1-メトキシエチリデンアミノ)フタル酸ジアミド1.4gのオルト酢酸トリメチル5ml溶液にパラトルエン
20 スルホン酸0.2gを添加し、60℃にて30分攪拌した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去し、残留した固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物1.4gを白色結晶として得た。

融点213.0~214.0℃

25 ¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.61 (bs, 1H), 8.32 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.35-7.6 (m, 4H), 6.90 (d, J=8.8Hz, 1H), 5.89 (d, J=8.5Hz, 1H), 4.05-4.25 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.05 (d, J=6.6Hz, 6H).

合成例2

3-(1-エトキシエチリデンアミノ)-N¹-(4-(2,2,2-トリフルオロ-1

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

233

ーヒドロキシー１ートリフルオロメチルエチル)ー２ーメチルフェニル)ー N^2 ーイソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1ー114)。

工程 1 ; N ー (4ー (2, 2, 2ートリフルオロー１ーヒドロキシー１ートリフルオロメチルエチル)ー２ーメチルフェニル)ー３ーニトロフタルイミドの製造。

- 5 ３ーニトロフタル酸無水物 2.8 g 及び 4ー (2, 2, 2ートリフルオロー１ーヒドロキシー１ートリフルオロメチルエチル)ー２ーメチルアニリン (ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1965 年、30 巻、1001 頁記載の化合物) 4.0 g の酢酸 50 ml 溶液を、加熱還流下にて 90 分攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去、残留物を酢酸エチル 200 ml に溶解し、水 100 ml、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 100 ml、水 100 ml の順で洗浄した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去することにより、目的物の粗生成物 6.78 g をアメ状固体として得た。このものは、精製することなく次の反応に用いた。
- 10

- ^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.24 (d, $J=7.7\text{Hz}$, 1H), 8.20 (d, $J=7.7\text{Hz}$, 1H),
15 8.01 (t, $J=7.7\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.68 (d, $J=8.2\text{Hz}$, 1H), 7.30 (d, $J=8.2\text{Hz}$, 1H), 3.67 (bs, 1H), 2.28 (s, 3H).

工程 2 ; N^1 ー (4ー (2, 2, 2ートリフルオロー１ーヒドロキシー１ートリフルオロメチルエチル)ー２ーメチルフェニル)ー N^2 ーイソプロピルー３ーニトロフタル酸ジアミドの製造。

- 20 N ー (4ー (2, 2, 2ートリフルオロー１ーヒドロキシー１ートリフルオロメチルエチル)ー２ーメチルフェニル)ー３ーニトロフタルイミド 3.9 g のジオキサン 40 ml 溶液に、イソプロピルアミン 2.5 g を添加し、室温にて 4 日間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去することにより得られた固体を酢酸エチルージイソプロピルエーテル混合溶媒にて洗浄し、目的物 3.1 g を淡黄色結晶として得た。

- 25 融点 155.0~157.0℃

^1H NMR (CDCl_3 - $\text{DMSO}-d_6$, Me_4Si , 300MHz) δ 9.89 (s, 1H), 8.66 (bs, 1H), 8.42 (d, $J=7.7\text{Hz}$, 1H), 8.17 (d, $J=8.0\text{Hz}$, 1H), 8.00 (d, $J=7.7\text{Hz}$, 1H), 7.75 (t, $J=7.7\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J=8.5\text{Hz}$, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.51 (d, $J=8.2\text{Hz}$, 1H), 3.85-3.95 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.03 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 6H).

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

234

工程 3 ; 3-アミノ-N¹-(4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル)-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミドの製造。

5 N¹-(4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル)-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-ニトロフタル酸ジアミド 3.0 g のメタノール 100 ml 溶液に、5%活性炭担持パラジウム 0.1 g を添加し、常圧水素雰囲気下にて 1 時間攪拌した。反応完結後、不溶物をセライト濾過、減圧下にて溶媒を留去することにより得られた固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物 2.3 g を白色結晶として得た。

10 融点 205.0~207.0℃

¹H NMR (CDCl₃-DMSO-d₆, Me₄Si, 300MHz) δ 9.32 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.85 (d, J=8.0Hz, 1H), 7.74 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.14 (d, J=8.8Hz, 1H), 7.15 (t, J=7.8Hz, 1H), 6.75-6.85 (m, 2H), 5.25 (s, 2H), 3.85-4.0 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 0.99 (d, J=6.3Hz, 6H).

15 工程 4 ; 3-(1-エトキシエチリデンアミノ)-N¹-(4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル)-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミドの製造。

3-アミノ-N¹-(4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル)-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 2.2 g
20 のオルト酢酸トリエチル 30 ml 溶液にパラトルエンスルホン酸 0.05 g を添加し、80℃にて 30 分攪拌した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去し、残留した固体をジイソプロピルエーテル-ヘキサン混合溶媒にて洗浄し、目的物 2.3 g を白色結晶として得た。
融点 164.0~166.0℃

25 ¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.47 (bs, 1H), 8.16 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.5-7.6 (m, 3H), 7.42 (t, J=7.7Hz, 1H), 6.88 (d, J=6.9Hz, 1H), 5.88 (d, J=7.7Hz, 1H), 4.44 (s, 1H), 4.20 (q, J=7.2Hz, 2H), 4.05-4.2 (m, 1H), 2.33 (s, 3H), 1.88 (s, 3H), 1.33 (t, J=7.2Hz, 3H), 1.10 (d, J=6.6Hz, 6H).

合成例 3

3-エチルアミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

235

N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-005)。

合成例 1 にて合成した N¹- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -N²-イソプロピル-3- (1-メトキシエチリデンアミノ) フタル酸ジアミド 1.4 g の酢酸 20 ml 溶液に、攪拌下室温にて、シアノ水素化ホウ素ナトリウム 0.33 g を 5 3 回に分割して添加した。同温度にて更に 1 時間攪拌を継続した後水 30 ml にて希釈、酢酸エチル 30 ml にて抽出し、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物 0.73 g を白色結晶として得た。

融点 208.0~209.0℃

10 ¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.43 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.45 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.32 (t, J=7.4Hz, 1H), 6.88 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.78 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.10 (d, J=7.7Hz, 1H), 5.43 (bs, 1H), 4.05-4.2 (m, 1H), 3.18 (q, J=7.0Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.28 (t, J=7.0Hz, 3H), 1.03 (d, J=6.6Hz, 6H).

合成例 4

15 3-エチルアミノ-N¹- (4- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル) -2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-006)。

合成例 2 にて合成した 3- (1-エトキシエチリデンアミノ) -N¹- (4- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル) -2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 2.0 g の酢酸 13 ml 溶液に、攪拌下室温にて、シアノ水素化ホウ素ナトリウム 0.46 g を 3 回に分割して添加した。同温度にて更に 50 分間攪拌を継続した後、酢酸エチル 100 ml にて希釈、水 50 ml ついで飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 50 ml にて洗浄した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去することにより得られた残留固体を酢酸エチル-ヘキサン (1:1) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 1.8 g を白色結晶として得た。

融点 139.0~140.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.30 (d, J=8.8Hz, 1H), 7.5-7.6 (m, 3H), 7.32 (t, J=8.0Hz, 1H), 6.87 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.76 (d, J=8.2Hz, 1H), 6.14 (d, J=7.7Hz,

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

236

1H), 5.34 (t, J=4.7Hz, 1H), 4.38 (s, 1H), 4.05-4.15 (m, 1H), 3.1-3.25 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.28 (t, J=6.9Hz, 3H), 1.03 (d, J=6.6Hz, 6H).

合成例 5

3-(N-エチルアセトアミド)-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-055)。

合成例 3 にて合成した 3-エチルアミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 0.42g 及びピリジン 0.1g のジクロロメタン 20ml 溶液に、氷冷攪拌下、塩化アセチル 0.097g を添加し、室温にて 12 時間攪拌した。反応完結後、水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体をジイソプロピルエーテル-ヘキサン混合溶媒にて洗浄し、目的物 0.34g を白色結晶として得た。

融点 144.0 ~ 147.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 9.03 and 8.39 (bs, 1H), 8.26 and 8.31 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.96 and 7.88 (dd, J=8.0, 1.1Hz, 1H), 7.57 and 7.60 (t, J=7.8Hz, 1H), 7.4-7.5 (m, 2H), 7.26 and 7.34 (dd, J=7.7, 1.1Hz, 1H), 6.62 and 5.73 (d, J=8.2Hz, 1H), 4.1-4.25 (m, 1H), 3.7-3.85 and 4.25-4.4 (m, 1H), 3.55-3.7 and 3.05-3.2 (m, 1H), 2.40 and 2.38 (s, 3H), 2.26 and 1.87 (s, 3H), 1.25 and 1.17 (t, J=7.2Hz, 3H), 1.09 and 1.16 (d, J=6.6Hz, 6H).

合成例 6

N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-1-エチル-4-イソプロピル-3H-1,4-ベンゾジアゼピン-2,5(1H,4H)-ジオン-6-カルボキサミド (本発明化合物 No. 8-001)。

合成例 5 と同様に合成した 3-(2-クロロ-N-エチルアセトアミド)-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-086) 0.39g の N,N-ジメチルホルムアミド 5ml 溶液に炭酸カリウム 0.14g を添加し、室温にて 3 時間攪拌した。反応完結後、ジエチルエーテル 50ml にて希釈し、水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物 0.26g を白色結晶として得た。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

237

融点 138.0 ~ 140.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.38 (bs, 1H), 8.30 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.4-7.65 (m, 3H), 7.39 (bs, 1H), 7.3-7.4 (m, 1H), 4.8-5.0 (m, 1H), 4.2-4.35 (m, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.6-3.8 (m, 1H), 2.43 (s, 3H), 1.2-1.3 (m, 9H).

5 合成例 7

3- (N-エチルアセトアミド) -N¹- (4- (1, 1, 2-トリフルオロ-2- (ヘプタフルオロプロピルオキシ) エトキシ) -2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-068)。

合成例 2 及び 4 と同様に合成した 3-エチルアミノ-N¹- (4- (1, 1, 2-トリフル
10 ルオロ-2- (ヘプタフルオロプロピルオキシ) エトキシ) -2-メチルフェニル) -N²-
イソプロピルフタル酸ジアミド 7.40g 及びピリジン 1.04g のジクロロメタン 70
ml 溶液に、氷冷撹拌下、塩化アセチル 1.04g を添加し、室温にて 35 分撹拌した。反
応完結後、反応混合物に氷水 100ml を加え有機層を分取、水層はクロロホルム 150
ml にて抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾
15 燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチル-ヘキサン (1:4) にて溶出
するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 6.75g を白色結晶とし
て得た。

融点 84.0 ~ 86.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.87 and 8.32 (bs, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.65
20 and 7.92 (d, J=7.8Hz, 1H), 7.53 (t, J=8.1Hz, 1H), 7.31 and 7.24 (dd, J=7.5,
0.9Hz, 1H), 7.04 (bs, 2H), 6.67 and 6.42 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.07 (dt, J=5.4,
2.7Hz, 1H), 4.2-4.4 and 3.05-3.2 (m, 1H), 4.05-4.2 and 4.1-4.25 (m, 1H), 3.55-
3.75 and 3.6-3.8 (m, 1H), 2.34 and 2.31 (s, 3H), 2.25 and 1.86 (s, 3H), 1.25
and 1.15 (t, J=7.2Hz, 3H), 1.08 and 1.09 (d, J=6.6Hz, 6H).

25 合成例 8

3-エチル (メチル) アミノ-N¹- (4- (1, 1, 2-トリフルオロ-2- (ヘプタ
フルオロプロピルオキシ) エトキシ) -2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル
酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-045)。

合成例 2 及び 4 と同様に合成した 3-エチルアミノ-N¹- (4- (1, 1, 2-トリフ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

238

ルオロー 2- (ヘプタフルオロプロピルオキシ) エトキシ) -2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 0.70g 及び 3.7%ホルムアルデヒド水溶液 0.45g のアセトニトリル 25ml 懸濁液に、室温にてシアノ水素化ホウ素ナトリウム 0.21g を添加し、更に酢酸 0.2ml を 10 分間にわたって滴下した。室温にて 3 時間攪拌を継続し
 5 した後、反応混合物にジエチルエーテル 30ml 及び 1N 水酸化カリウム水溶液 30ml を加え有機層を分取、水層はさらにジエチルエーテル 30ml を用いて抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチル-ヘキサン (1:1) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 0.56g を白色結晶として得た。

10 融点 127.0~132.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz) δ 8.34 (bs, 1H), 8.04 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.35-7.5 (m, 2H), 7.22 (d, J=7.0Hz, 1H), 6.95-7.1 (m, 2H), 6.40 (d, J=7.2Hz, 1H), 6.06 (td, J=53.6, 2.6Hz, 1H), 4.15-4.3 (m, 1H), 3.08 (q, J=7.2Hz, 2H), 2.75 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.16 (d, J=6.4Hz, 6H), 1.09 (t, J=7.2Hz, 3H).

15 合成例 9

N- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -1-エチル-3-イソプロピル-4-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン-5-カルボキサミド (本発明化合物 No. 5-008)。

合成例 3 にて合成した 3-エチルアミノ-N¹- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 0.33g 及びピリジン 0.23g のジクロロメタン 20ml 溶液に、氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル 0.23g を添加し、室温にて 12 時間攪拌した。反応完結後、水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチル-ヘキサン (1:2) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、
 20 目的物 0.26g を白色結晶として得た。

融点 96.0~98.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.40 (br, 1H), 7.83 (bs, 1H), 7.65 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.01 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.87 (d, J=8.2Hz, 1H), 4.85-4.95 (m, 1H), 4.41 (s, 2H), 3.45 (q, J=7.1Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.25 (t, J=7.1Hz,

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

239

3H), 1.19 (d, J=6.8Hz, 6H).

合成例 10

N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-1-エチル-3-イ
ソプロピル-2-メチル-4-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン-5
5 -カルボキサミド (本発明化合物 No. 7-001)。

合成例 3 にて合成した 3-エチルアミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2
-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 0.13g 及びアセトアルデヒ
ド 5ml に、パラトルエンスルホン酸 0.01g を添加し、室温にて 12 時間攪拌した。反
応完結後、ジエチルエーテル 20ml を加えて希釈後水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫
10 酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチル-
ヘキサン (2:3) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目
的物 0.13g を乳白色結晶として得た。

融点 91.0~93.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.43 (br, 1H), 8.07 (bs, 1H), 7.46 (d, J=8.5Hz,
15 1H), 7.3-7.45 (m, 2H), 7.03 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.82 (d, J=8.2Hz, 1H), 4.85-4.95
(m, 1H), 4.74 (q, J=6.0Hz, 1H), 3.4-3.6 (m, 1H), 3.15-3.3 (m, 1H), 2.35 (s, 3H),
1.30 (t, J=7.1Hz, 3H), 1.15-1.4 (m, 9H).

合成例 11

3-ジメチルアミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)
20 -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-042)。

合成例 1 の工程 1 にて合成した 3-アミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-
2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 0.97g 及び 37%ホルム
アルデヒド水溶液 1.6g のアセトニトリル 30ml 懸濁液にシアノ水素化ホウ素ナトリウ
ム 0.38g を添加し、室温にて 30 分攪拌した後、酢酸 0.5ml を 10 分間にわたって
25 滴下、更に室温にて 3 時間攪拌を継続した。反応完結後ジエチルエーテル 100ml で希
釈し、1N 水酸化カリウム水溶液にて洗浄 (20ml x 3)、有機層を飽和食塩水、無水硫酸
ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘ
キサン (1:1) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的
物 0.53g を白色結晶として得た。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

240

融点 216.0 ~ 219.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.44 (bs, 1H), 8.33 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.35-7.5 (m, 4H), 7.22 (d, J=8.2Hz, 1H), 6.36 (bs, 1H), 4.15-4.25 (m, 1H), 2.86 (s, 6H), 2.39 (s, 3H), 1.16 (d, J=6.5Hz, 6H).

5 合成例 1 2

3-アセトアミド-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-028)。

合成例 1 の工程 1 にて合成した 3-アミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピルフタル酸ジアミド 0.55g 及びトリエチルアミン 0.25g のジクロロメタン 30ml 溶液に、氷冷撹拌下、塩化アセチル 0.16g を添加し、室温に昇温後 12 時間撹拌を継続した。反応完結後、水 10ml にて洗浄、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。残留した固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物 0.2g を白色結晶として得た。

15 融点 208.0 ~ 210.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 9.01 (bs, 1H), 8.3-8.45 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.54 (t, J=8.0Hz, 1H), 7.53 (d, J=7.9Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.37 (d, J=7.7Hz, 1H), 6.39 (d, J=7.7Hz, 1H), 4.05-4.2 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.07 (d, J=6.6Hz, 6H).

20 合成例 1 3

N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-(N-メチルホルムアミド)フタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-049) 及び N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-6-(N-メチルホルムアミド)フタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 2-003)。

25 工程 1 ; 3-ホルムアミド-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イミドの製造。

ギ酸 0.97g 及び無水酢酸 1.6g の混合物を 50 °C にて 1 時間撹拌した後、氷冷撹拌下、3-アミノ-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イミド 2.2g のテトラヒドロフラン 20ml 溶液を添加し、更に室温にて 12 時間撹拌

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

241

を継続した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去、残留物を酢酸エチル 30 ml に溶解、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 20 ml にて洗浄した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下に溶媒を留去し、粗製の目的物 2.2 g を白色結晶として得た。

5 融点 202.0 ~ 205.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 9.49 (s, 1H), 8.88 (d, J=8.5Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.80 (t, J=7.4Hz, 1H), 7.68 (d, J=7.1Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.58 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.34 (d, J=8.5Hz, 1H), 2.30 (s, 3H).

工程 2 ; N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-3-(N-メ

10 チルホルムアミド) フタル酸イミドの製造。

3-ホルムアミド-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) フタル酸イミド 2.2 g のジメチルホルムアミド 30 ml 溶液に、氷冷攪拌下、60%油性水素下ナトリウム 0.2 g を添加し同温度にて 10 分間攪拌、続けてヨウ化メチル 0.9 g を添加し、室温に昇温後、更に 1.5 時間攪拌を継続した。反応完結後、氷水 30 ml に投入
15 しジエチルエーテル 30 ml にて 2 回抽出した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下に溶媒を留去、残留固体をジイソプロピルエーテル-ヘキサン (1 : 2) 混合溶媒にて洗浄し、目的物 1.78 g を淡黄色結晶として得た。

融点 111.0 ~ 114.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.51 (s, 1H), 7.93 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.88 (t, J=7.4Hz, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.57 (d, J=7.6Hz, 1H), 7.57 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.35 (d, J=8.2Hz, 1H), 3.44 (s, 3H), 2.29 (s, 3H).

工程 3 ; N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロ
ピル-3-(N-メチルホルムアミド) フタル酸ジアミド及び N¹-(4-ヘプタフルオロ
イソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-6-(N-メチルホルムアミ
25 ド) フタル酸ジアミドの製造。

N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-3-(N-メチルホルムアミド) フタル酸イミド 0.6 g の 1, 4-ジオキサン 20 ml 溶液にイソプロピルアミン 1.8 ml を添加し、50 °C にて 7 時間攪拌した。反応完結後室温まで放冷、減圧下に溶媒を留去、残留固体を酢酸エチル続けて酢酸エチル-メタノール (19 : 1) にて溶

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

242

出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、酢酸エチルフラクションより
 N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-6
 -(N-メチルホルムアミド)フタル酸ジアミド0.54gを白色結晶として、酢酸エチル
 -メタノール(19:1)フラクションより N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-
 5 2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-3-(N-メチルホルムアミド)フタル酸ジ
 アミド0.03gを樹脂状固体として、それぞれ得た。

N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-6
 -(N-メチルホルムアミド)フタル酸ジアミド；

融点191.0~193.0℃

10 1H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si , 300MHz) δ 8.34 and 8.13 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 8.22 and 8.28 (s,
 1H), 7.91 and 7.82 (bs, 1H), 7.70 and 7.58 (dd, $J=7.7$, 1.1Hz, 1H), 7.5-7.65 (m,
 1H), 7.35-7.55 (m, 2H), 7.31 and 7.38 (dd, $J=7.7$, 1.1Hz, 1H), 6.13 and 6.01 (d,
 $J=6.5$ Hz, 1H), 4.15-4.4 (m, 1H), 3.33 and 3.28 (s, 3H), 2.32 and 2.33 (s, 3H),
 1.15 and 1.13 (d, $J=6.6$ Hz, 6H).

15 N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-3
 -(N-メチルホルムアミド)フタル酸ジアミド；

1H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si , 300MHz) δ 8.81 and 8.45 (bs, 1H), 8.31 and 8.29 (d, $J=8.5$ Hz,
 1H), 8.25 (s, 1H), 7.97 and 7.87 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 7.55-7.7 (m, 1H), 7.4-7.5 (m,
 2H), 7.39 and 7.33 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 6.39 and 5.77 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 3.35 and
 20 3.28 (s, 3H), 2.40 and 2.39 (s, 3H), 1.11 (d, $J=6.6$ Hz, 6H).

合成例 14

3-(3,3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)- N^1 -(4-ヘプタフル
 オロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピルフタル酸ジアミド(本発明
 化合物 No. 1-097)。

25 工程 1 ; 2-(2-クロロ-1,1-ジメチルプロパノイルアミノ)-N-イソプロピル
 ベンズアミドの製造。

2-アミノ-N-イソプロピルベンズアミド6.0g及びトリエチルアミン6.81gの
 ジクロロメタン40ml溶液に、氷冷攪拌下、ジクロロメタン30mlに溶解した2-クロ
 ロ-1,1-ジメチルプロパノイルクロライド6.26gを滴下し、滴下終了後室温にて

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

243

さらに12時間撈拌を継続した。反応完結後、反応混合物を酢酸エチル200mlにて希釈し、水100ml、1N塩酸50ml、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液50mlの順で洗浄、さらに飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。残留する赤色固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物8.4gを肌色結晶として得た。

融点134.0~136.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz) δ 11.41 (bs, 1H), 8.59 (dd, J=8.0, 1.2Hz, 1H), 7.4-7.5 (m, 2H), 7.05-7.1 (m, 1H), 6.10 (d, J=6.4Hz, 1H), 4.2-4.3 (m, 1H), 3.71 (s, 2H), 1.43 (s, 6H), 1.28 (d, J=6.4Hz, 6H).

10 工程2; 2-(3, 3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)-N-イソプロピルベンズアミドの製造。

2-(2-クロロ-1, 1-ジメチルプロパノイルアミノ)-N-イソプロピルベンズアミド8.06gのジクロロメタン87ml溶液にテトラブチルアンモニウムブロマイド0.87gを添加し、室温にて撈拌下、水酸化ナトリウム34.7gの水87ml溶液を滴下し

15 た。室温にてさらに9時間撈拌を継続した後、反応混合物に水200mlを加えジクロロメタン層を分取、水層はさらにジクロロメタンにて抽出(100ml x 2)した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去、残留した褐色油状物質を酢酸エチル-ノルマルヘキサン(2:3)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物6.26gを乳白色結晶として得た。

20 融点129.5~131.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz) δ 7.75-7.8 (m, 1H), 7.35-7.4 (m, 2H), 7.1-7.2 (m, 1H), 6.03 (d, J=7.2Hz, 1H), 4.17-4.3 (m, 1H), 3.56 (s, 2H), 1.38 (s, 6H), 1.26 (d, J=6.4Hz, 6H).

25 工程3; 3-(3, 3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)-2-イソプロピルカルバモイル安息香酸の製造。

2-(3, 3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)-N-イソプロピルベンズアミド5.83gのテトラヒドロフラン67ml溶液に、-78℃にて撈拌下、0.99Mセカンダリーブチルリチウムヘキサン溶液50mlを滴下した。-78℃にて1時間撈拌を継続した後、室温に昇温、炭酸ガスを30分間導入した。さらに室温にて1時間撈

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

244

拌を継続した後、氷冷下に水 150 ml を加え、濃塩酸を加えて pH を 2～3 に調節した後、酢酸エチルにて抽出 (100 ml x 3) した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下に溶媒を留去、残留した黄色固体をジエチルエーテルにて洗浄し、目的物 3.38 g をレモン色結晶として得た。

- 5 工程 4 ; 3 - (3, 3 - ジメチル - 2 - オキソアゼチジン - 1 - イル) - N¹ - (4 - ヘプタフルオロイソプロピル - 2 - メチルフェニル) - N² - イソプロピルフタル酸ジアミドの製造。

- 3 - (3, 3 - ジメチル - 2 - オキソアゼチジン - 1 - イル) - 2 - イソプロピルカルバモイル安息香酸 1.0 g のトルエン 22 ml 溶液に、室温にて攪拌下、無水トリフルオロ酢酸 0.93 g を滴下した。同温度にて 30 分攪拌した後、減圧下に溶媒を留去、残留する黄色油状物質をテトラヒドロフラン 25 ml に溶解、4 - ヘプタフルオロイソプロピル - 2 - メチルアニリン 0.9 g を添加し、室温にて 17 時間攪拌を継続した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去、残留した黄色固体を酢酸エチル - ノルマルヘキサン (1 : 2) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 1.06 g を
15 白色結晶として得た。

融点 217.0 ~ 217.5 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz) δ 8.35 (d, J=8.4Hz, 1H), 8.21 (bs, 1H), 8.07 (dd, J=7.8, 1.4Hz, 1H), 7.38-7.55 (m, 4H), 6.37 (d, J=8.0Hz, 1H), 4.07-4.23 (m, 1H), 3.62 (s, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.39 (s, 6H), 1.10 (d, J=6.8Hz, 6H).

- 20 本発明化合物は、前記製造法及び実施例に準じて製造することができる。そのような化合物の例を第 7 表～第 14 表に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

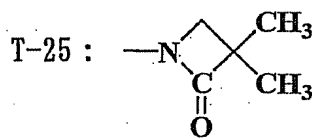
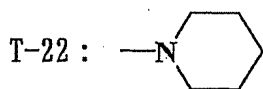
- 尚、表中 Et との記載はエチル基を表し、以下同様に n-Pr 又は Pr-n はイソプロピル基を、i-Pr 又は Pr-i はイソプロピル基を、n-Bu 又は Bu-n はノルマルブチル基を、s-Bu 又は Bu-s はセカンダリーブチル基を、i-Bu 又は Bu-i はイソブチル基を、t-Bu 又は Bu-t
25 はターシャリーブチル基を、c-Pen 又は Pen-c はシクロペンチル基を、c-Hex 又は Hex-c はシクロヘキシル基を、Ph はフェニル基をそれぞれ表し、

また、表中 T-22 及び T-25 は、それぞれ下記の構造を表し、

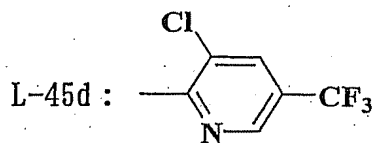
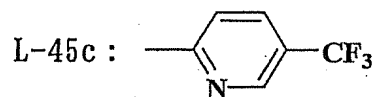
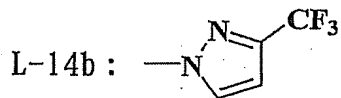
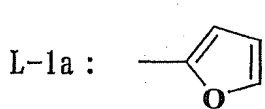
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

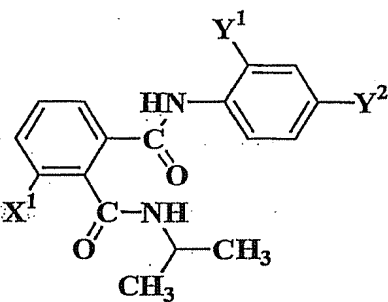
245



さらに、表中 L-1a、L-14b、L-45c 及び L-45d は、それぞれ下記の構造を表す。



第7表



5

No.	X ¹	Y ¹	Y ²	m. p. (°C)
10	1-001 NHEt	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	153.0-158.0
	1-002 NHEt	Br	C(CF ₃) ₂ OH	90.0-92.0
	1-003 NHEt	Br	OCF ₃	164.5-165.5
	1-004 NHEt	CH ₃	H	183.0-185.0
	1-005 NHEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	208.0-209.0
	1-006 NHEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	139.0-140.0
	1-007 NHEt	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	201.0-202.0
15	1-008 NHEt	CH ₃	OCF ₃	188.0-190.0
	1-009 NHEt	CH ₃	OCF ₂ Br	186.0-187.0
	1-010 NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	167.0-169.0
	1-011 NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	173.0-174.0
	1-012 NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	147.0-148.0
20	1-013 NHEt	CH ₃	O(L-45d)	217.0-218.0
	1-014 NHEt	CH ₃	L-45d	196.0-197.0
	1-015 NHEt	CF ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	159.0-163.0
	1-016 NHEt	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	149.5-151.0
	1-017 NHPi-n	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	193.0-195.0
25	1-018 NHBu-n	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	172.0-173.0

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

246

	1-019	NHPen-c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	197.0-199.0
	1-020	NHCH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	175.0-178.0
	1-021	NHCH ₂ OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	173.0-174.0
	1-022	NHCH ₂ OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	115.0-120.0
5	1-023	NHCH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	170.0-172.0
	1-024	NHCH(Et)OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	191.0-193.0
	1-025	NHCH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	200.0-202.0
	1-026	NHCH ₂ (L-1a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	196.0-199.0
	1-027	NHCHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	189.0-191.0
10	1-028	NHC(O)CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	208.0-210.0
	1-029	NHC(O)Bu-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	184.0-187.0
	1-030	NHC(O)C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	198.5-200.5
	1-031	NHC(O)CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	239.0-240.0
	1-032	NHC(O)Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	211.0-213.0
15	1-033	NHC(O)OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	195.0-196.0
	1-034	NHC(O)OBu-i	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	180.0-181.0
	1-035	NHC(O)OCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	178.0-180.0
	1-036	NHC(O)OCH ₂ CCl ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	223.5-224.5
	1-037	NHC(O)C(O)OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	156.0-157.0
20	1-038	NHC(O)C(O)OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	212.0-213.0
	1-039	NHOH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	175.0-177.0
	1-040	NHSCCl ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	191.0-193.0
	1-041	NHSO ₂ CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	194.0-197.0
	1-042	N(CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	216.0-219.0
25	1-043	N(CH ₃)Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	187.0-188.0
	1-044	N(CH ₃)Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	178.0-180.0
	1-045	N(CH ₃)Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	127.0-132.0
	1-046	N(Et) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	110.0-111.0
	1-047	N(CH ₃)Bu-n	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	206.0-207.0
30	1-048	T-22	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	211.0-212.0
	1-049	N(CH ₃)CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
	1-050	N(Et)CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	190.0-192.0
	1-051	N(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	170.0-171.0
	1-052	N(Et)C(O)CH ₃	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	149.0-154.0
35	1-053	N(Et)C(O)CH ₃	Br	C (CF ₃) ₂ OH	201.0-202.0
	1-054	N(Et)C(O)CH ₃	Br	OCF ₃	217.0-217.5
	1-055	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	144.0-147.0
	1-056	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	222.0-223.0
	1-057	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	124.0-126.0
40	1-058	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₃	94.0-96.0
	1-059	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	85.0-87.0
	1-060	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	100.0-102.0
	1-061	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	141.0-143.0
	1-062	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	179.0-181.0
45	1-063	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CCl ₃	201.0-203.0
	1-064	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCH (CF ₃) ₂	197.0-199.0
	1-065	N(Et)C(O)CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	146.0-148.0

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

247

	1-066	N(Et) C(O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	174.0-176.0
	1-067	N(Et) C(O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	171.0-172.0
	1-068	N(Et) C(O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	84.0-86.0
	1-069	N(Et) C(O) CH ₃	CH ₃	O(L-45d)	109.0-110.0
5	1-070	N(Et) C(O) CH ₃	CH ₃	L-45d	177.0-179.0
	1-071	N(Et) C(O) CH ₃	CF ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	148.0-149.0
	1-072	N(Et) C(O) CH ₃	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	120.0-121.5
	1-073	N(Et) C(O) CH ₃	L-14b	CF ₃	180.0-182.0
	1-074	N(Pr-n) C(O) CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	樹脂状
10	1-075	N(Pr-i) C(O) CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	102.0-105.0
	1-076	N(Bu-n) C(O) CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	樹脂状
	1-077	N(Pen-c) C(O) CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	98.0-102.0
	1-078	N(CH ₂ Ph) C(O) CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	162.0-166.0
	1-079	N(OC(O)CH ₃) C(O) CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	178.0-179.0
15	1-080	N(Et) C(O) Et	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	184.0-186.0
	1-081	N(Et) C(O) Pr-n	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	127.0-130.0
	1-082	N(Et) C(O) Pr-i	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	159.0-163.0
	1-083	N(Et) C(O) Pr-c	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	162.0-168.0
	1-084	N(Et) C(O) Bu-t	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	樹脂状
20	1-085	N(Et) C(O) Hex-c	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	146.0-149.0
	1-086	N(Et) C(O) CH ₂ Cl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	樹脂状
	1-087	N(Et) C(O) CF ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	208.0-210.0
	1-088	N(Pr-n) C(O) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	166.0-168.0
	1-089	N(Et) C(O) CH ₂ C(O)OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	194.0-196.0
25	1-090	N(Et) C(O) CH=CHCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	171.0-172.0
	1-091	N(Et) C(O) Ph	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	197.0-200.0
	1-092	N(Et) C(O) (Ph-2-Cl)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	179.0-181.0
	1-093	N(Et) C(O) (Ph-3-Cl)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	168.0-170.0
	1-094	N(Et) C(O) (Ph-4-Cl)	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	167.0-169.0
30	1-095	N(Et) C(O) CH ₂ Ph	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	178.0-180.0
	1-096	T-25	Br	C(CF ₃) ₂ OH	209.5-211.0
	1-097	T-25	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	217.0-217.5
	1-098	N(Et) C(O) OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	177.0-179.0
	1-099	N(Et) C(O) OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	179.0-181.0
35	1-100	N(Et) C(O) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	102.0-104.0
	1-101	N(Pr-n) C(O) OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	179.0-180.0
	1-102	N(Et) C(O) OCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	151.0-153.0
	1-103	N(Et) C(O) OPh	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	183.0-184.0
	1-104	N(Et) C(O) SPh	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	224.0-226.0
40	1-105	N(Et) C(O) C(O) OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	199.0-201.0
	1-106	N(Et) C(O) C(O) OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	樹脂状
	1-107	N(Et) SCl ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	195.0-196.0
	1-108	N=C(CH ₃) OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	213.0-214.0
	1-109	N=C(CH ₃) OEt	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	120.0-141.0
45	1-110	N=C(CH ₃) OEt	Br	OCF ₃	168.0-170.0
	1-111	N=C(CH ₃) OEt	Br	C(CF ₃) ₂ OH	180.0-182.0
	1-112	N=C(CH ₃) OEt	CH ₃	H	192.0-194.0

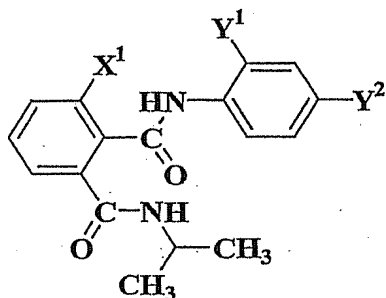
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

248

	1-113	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	181.0-182.0
	1-114	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	164.0-166.0
	1-115	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	180.0-181.0
	1-116	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	OCF ₃	174.0-175.5
5	1-117	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	OCF ₂ Br	171.0-171.5
	1-118	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	164.0-166.0
	1-119	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	175.0-176.0
	1-120	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	162.0-164.0
	1-121	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	O (L-45d)	173.0-174.0
10	1-122	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	L-45d	207.0-209.0
	1-123	N=C (CH ₃) OEt	CF ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	123.0-126.0
	1-124	N=C (CH ₃) OEt	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	161.0-162.0
	1-125	N=C (Et) OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	193.0-194.0
	1-126	N=C (Pr-n) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	171.0-174.0
15	1-127	NHEt	CH ₃	O (L-45c)	178.0-180.0
	1-128	N (Et) C (O) CH ₃	CH ₃	O (L-45c)	246.0-248.0
	1-129	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	O (L-45c)	128.0-130.0
	1-130	NHEt	CH ₃	L-45c	221.0-223.0
	1-131	N (Et) C (O) CH ₃	CH ₃	L-45c	205.0-207.0
20	1-132	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	L-45c	202.0-203.0

第 8 表



25

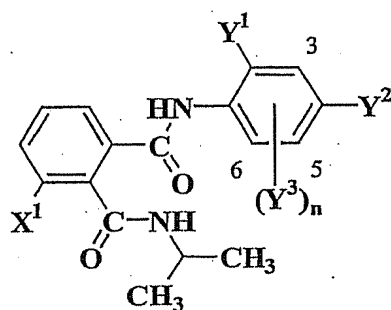
No.	X¹	Y¹	Y²	m. p. (°C)
2-001	NHEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	245.0-246.0
2-002	NHCHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	178.0-180.0
30 2-003	N (CH ₃) CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	191.0-193.0

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

249

第9表



No.	X¹	Y¹	Y²	(Y³)ₙ	m.p. (°C)
5	3-001 NHEt	H	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-CH₃	95.0-97.0
	3-002 NHEt	CH₃	OCF₂Br	3-Cl	200.0-202.0
	3-003 NHEt	CH₃	OCF₂Br	5-Cl	180.0-182.0
	3-004 NHEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-Cl	167.0-168.0
10	3-005 NHEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-CH₃	192.0-193.0
	3-006 NHEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	5-Cl	159.0-161.0
	3-007 NHEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3,5-Cl₂	176.0-177.0
	3-008 NHEt	CH₃	O (L-45d)	3,5-Cl₂	213.0-215.0
	3-009 N (Et) C (O) CH₃	H	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-CH₃	164.0-168.0
15	3-010 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	OCF₂Br	3-Cl	110.0-112.0
	3-011 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	OCF₂Br	5-Cl	93.0-95.0
	3-012 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-Cl	210.0-212.0
	3-013 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-CH₃	90.0-92.0
	3-014 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	5-Cl	78.0-80.0
20	3-015 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3,5-Cl₂	94.0-96.0
	3-016 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	O (L-45d)	3,5-Cl₂	131.0-133.0
	3-017 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	Cl	5-O (L-45d)	216.0-218.0
	3-018 N=C (CH₃) OEt	H	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-CH₃	150.0-160.0
	3-019 N=C (CH₃) OEt	CH₃	OCF₂Br	3-Cl	175.0-176.0
25	3-020 N=C (CH₃) OEt	CH₃	OCF₂Br	5-Cl	178.0-180.0
	3-021 N=C (CH₃) OEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-Cl	164.0-165.0
	3-022 N=C (CH₃) OEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3-CH₃	163.0-165.0
	3-023 N=C (CH₃) OEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	5-Cl	192.0-193.5
	3-024 N=C (CH₃) OEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	3,5-Cl₂	181.0-182.0
30	3-025 NHEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	6-CH₃	185.0-187.0
	3-026 N (Et) C (O) CH₃	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	6-CH₃	97.0-99.0
	3-027 N=C (CH₃) OEt	CH₃	OCF₂CHFOCF₂CF₂CF₃	6-CH₃	171.0-173.0

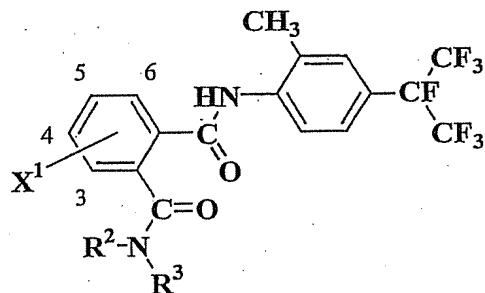
35

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

250

第 10 表



No.	X ¹	R ²	R ³	m. p. (°C)
5	4-001 3-NHEt	H	Et	187.0-189.0
	4-002 3-NHEt	H	s-Bu	195.0-197.0
	4-003 3-NHEt	H	i-Bu	125.0-128.0
	4-004 3-NHEt	H	t-Bu	210.0-212.0
10	4-005 3-NHEt	H	c-Pen	樹脂状
	4-006 3-NHEt	H	c-Hex	195.0-196.0
	4-007 3-NHEt	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	151.5-152.5
	4-008 3-NHEt	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	103.0-105.0
	4-009 3-NHEt	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	118.0-120.0
15	4-010 3-NHEt	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	181.0-183.0
	4-011 3-NHOH	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	166.0-168.0
	4-012 3-N(Et)C(O)CH ₃	H	Et	104.0-106.0
	4-013 3-N(Et)C(O)CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	85.0-87.0
	4-014 3-N(Et)C(O)CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	89.0-91.0
20	4-015 3-N(Et)C(O)CH ₃	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	110.0-112.0
	4-016 3-N(Et)C(O)CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	80.0-81.0
	4-017 3-N=CHOEt	H	t-Bu	186.0-188.0
	4-018 3-N=C(CH ₃)OEt	H	Et	162.0-163.0
	4-019 3-N=C(CH ₃)OEt	H	s-Bu	173.0-175.0
25	4-020 3-N=C(CH ₃)OEt	H	i-Bu	177.0-179.0
	4-021 3-N=C(CH ₃)OEt	H	t-Bu	173.0-174.0
	4-022 3-N=C(CH ₃)OEt	H	c-Pen	200.0-201.5
	4-023 3-N=C(CH ₃)OEt	H	c-Hex	210.0-212.0
	4-024 3-N=C(CH ₃)OEt	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	135.0-136.0
30	4-025 3-N=C(CH ₃)OEt	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	153.0-155.0
	4-026 3-N=C(CH ₃)OEt	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	165.0-167.0
	4-027 3-N=C(CH ₃)OEt	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	96.0-97.0

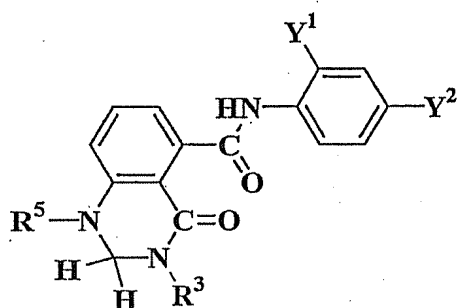
35

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

251

第 1 1 表



No.	R ³	R ⁵	Y ¹	Y ²	m. p. (°C)
5	5-001 Et	Et	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	167.0-168.0
	5-002 i-Pr	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	105.0-107.0
	5-003 i-Pr	CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	153.0-156.0
	5-004 i-Pr	Et	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	158.0-162.0
	5-005 i-Pr	Et	Br	C(CF ₃) ₂ OH	205.0-206.0
10	5-006 i-Pr	Et	Br	OCF ₃	53.0-55.0
	5-007 i-Pr	Et	CH ₃	H	165.0-167.0
	5-008 i-Pr	Et	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	96.0-98.0
	5-009 i-Pr	Et	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	250.0-251.0
	5-010 i-Pr	Et	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	90.0-92.0
15	5-011 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₃	91.0-92.0
	5-012 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ Br	66.0-68.0
	5-013 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	118.0-120.0
	5-014 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCI	80.0-81.0
	5-015 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	174.0-176.0
20	5-016 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CCl ₃	169.0-171.0
	5-017 i-Pr	Et	CH ₃	OCH(CF ₃) ₂	173.0-175.0
	5-018 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	80.0-82.0
	5-019 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	170.5-171.5
	5-020 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	87.0-89.0
25	5-021 i-Pr	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	67.0-69.0
	5-022 i-Pr	Et	CH ₃	O(L-45d)	98.0-99.0
	5-023 i-Pr	Et	CH ₃	L-45d	102.0-104.0
	5-024 i-Pr	Et	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	57.0-59.0
	5-025 i-Pr	Et	L-14b	CF ₃	213.0-215.0
30	5-026 i-Pr	n-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	87.0-89.0
	5-027 i-Pr	i-Pr	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	99.0-102.0
	5-028 i-Pr	n-Bu	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	135.0-137.0
	5-029 i-Pr	c-Pen	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	89.0-91.0
	5-030 i-Pr	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	107.0-110.0
35	5-031 i-Pr	CH ₂ OEt	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	86.0-89.0
	5-032 i-Pr	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	98.0-100.0
	5-033 i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	85.0-87.0
	5-034 i-Pr	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	91.0-95.0

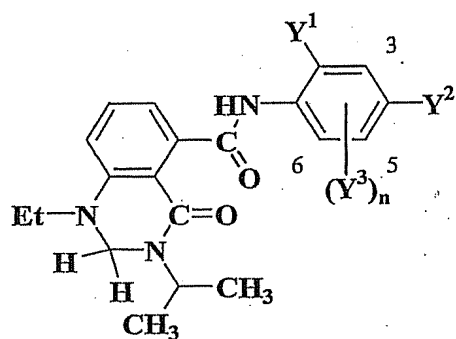
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

252

	5-035	i-Pr	CH ₂ (L-1a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	200.0-201.0
	5-036	i-Pr	C (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
	5-037	i-Pr	C (O) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	109.0-112.0
	5-038	i-Pr	SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	190.0-192.0
5	5-039	s-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	103.5-106
	5-040	i-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
	5-041	t-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	87.0-89.0
	5-042	c-Pen	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	97.0-99.0
	5-043	c-Hex	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	117.0-119.0
10	5-044	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	75.0-77.0
	5-045	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	170.0-171.0
	5-046	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	63.0-65.0
	5-047	i-Pr	Et	CH ₃	O (L-45c)	122.0-124.0
	5-048	i-Pr	Et	CH ₃	L-45c	138.0-140.0

第 1 2 表



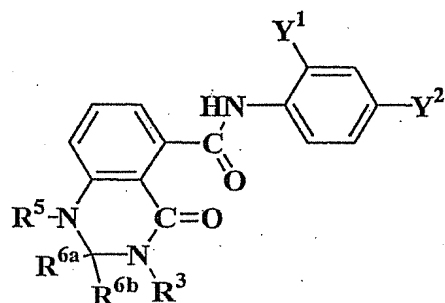
20	No.	Y ¹	Y ²	(Y ³) _n	m. p. (°C)
	6-001	H	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃	91.0-96.0
	6-002	CH ₃	Cl	5-O (L-45d)	150.0-152.0
	6-003	CH ₃	OCF ₂ Br	3-Cl	180.0-182.0
25	6-004	CH ₃	OCF ₂ Br	5-Cl	162.0-164.0
	6-005	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-Cl	85.0-87.0
	6-006	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃	78.0-80.0
	6-007	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-Cl	148.0-149.0
	6-008	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂	91.0-93.0
30	6-009	CH ₃	O (L-45d)	3, 5-Cl ₂	258.0-260.0
	6-010	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	6-CH ₃	80.0-81.0

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

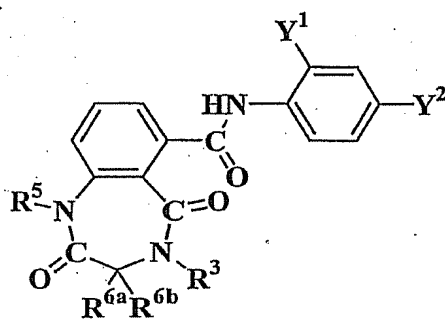
253

第 1 3 表



No.	R ³	R ⁵	R ^{6 a}	R ^{6 b}	Y ¹	Y ²	m. p. (°C)
5							
7-001	i-Pr	Et	CH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	91.0-93.0
7-002	i-Pr	Et	Et	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
7-003	i-Pr	Et	n-Pr	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
7-004	i-Pr	Et	n-Bu	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
10	7-005	i-Pr	Ph	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	107.0-109.0

第 1 4 表



No.	R ³	R ⁵	R ^{6 a}	R ^{6 b}	Y ¹	Y ²	m. p. (°C)
15							
8-001	i-Pr	Et	H	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	138.0-140.0

20

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

254

[試験例]

次に、本発明化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらだけに限定されるものではない。

試験例1 ハスモンヨトウに対する殺虫試験

- 5 本発明化合物の10%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、下記の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2区制で行
- 10 なった。

$$\text{死虫率 (\%)} = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

その結果、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

- 本発明化合物: No. 1-003~007、1-009~014、1-017、1-018、1-020~024、1-026~028、1-031、1-032、1-034
- 15 ~036、1-039、1-040、1-042~051、1-054~056、1-057、1-064、1-067~069、1-074~078、1-080~083、1-086~091、1-093~095、1-098~108、1-111、1-113~117、1-119~121、1-125、1-126、3-012、3-014~016、3-021、4-002、4-004、4-007、4-009、4-0
- 20 10~012、4-013、4-016~019、4-021、4-024、4-026、4-027、5-001、5-003、5-008、5-010、5-020~022、5-026~028、5-031~033、5-034、5-035、5-039、5-041、5-044~046、6-005、6-007、6-009、7-001、7-002

25 試験例2 コナガに対する殺虫試験

- 本発明化合物の10%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ (*Plutella xylostella*) の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の
- 30 死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2区制で行なった。

その結果、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

255

本発明化合物 : No. 1-001~014、1-017~070、1-074~084、
1-086~091、1-094、1-095、1-097~122、1-125~1
29、2-002、2-003、3-003、3-008、3-011~016、3-
020、4-001~027、5-001、5-003~023、5-026~047、
5 6-004~009、7-001~005、8-001

産業上の利用可能性

殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来の殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。また、殺虫剤の一部には毒性の高いもの、長く環境中に残留するものが存在し、これらによる生態系の攪乱が問題となっている。一方、本発明化合物は多くの農業害虫、ハダニ類に対して優れた殺虫・殺ダニ活性を有し、既存の殺虫剤に対して抵抗性を獲得した害虫に対しても十分な防除効果を発揮する。さらに、ホ乳類、魚類及び益虫に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で環境に対する負荷も軽い。

15 従って、本発明は有用な新規有害生物防除剤を提供することができる。

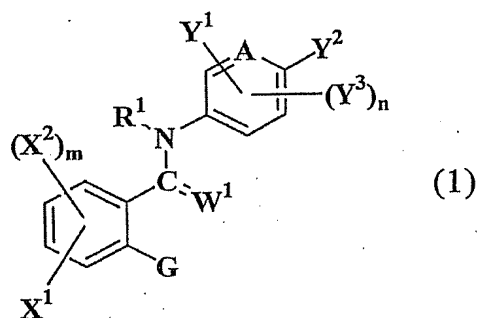
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

256

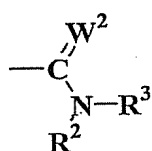
請求の範囲

1. 一般式 (1) :

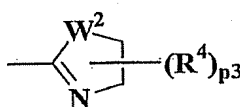


式中、A は、炭素原子又は窒素原子を表し、

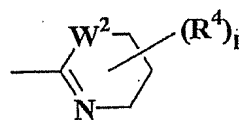
5 G は、G-1、G-2 又は G-3 を表し、



G-1



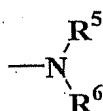
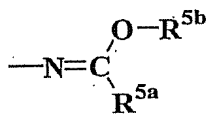
G-2



G-3

W¹ 及び W² は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

X¹ は、X¹-1 又は X¹-2 を表し、

X¹-1X¹-2

10 X² は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル又は C₁~C₆アルコキシカルボニルを表し、
m が 2 以上の整数を表すとき、各々の X² は互いに同一であっても、または相異なっているてもよく、

15 Y¹、Y² 及び Y³ は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF₅、C₁~C₆アルキル、R⁷ によって任意に置換された (C₁~C₆) アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R⁷ によって任意に置換された (C₃~C₈) シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、

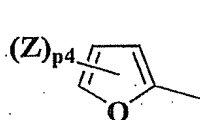
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

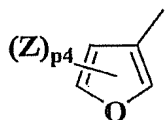
257

- R^7 によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、
 $-OH$ 、 $-OR^8$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_1 R^8$ 、 $-S(O)_2 OR^{10}$ 、 $-S(O)_2 NHR^{11}$ 、 $-S(O)_2 N(R^{11}) R^{10}$ 、 $-NHR^9$ 、 $-N(R^9) R^8$ 、
 $-CHO$ 、 $-C(O) R^{10}$ 、 $-C(O) OR^{10}$ 、 $-C(O) SR^{10}$ 、 $-C(O) NHR^{11}$ 、 $-C(O) N(R^{11}) R^{10}$ 、 $-C(S) OR^{10}$ 、 $-C(S) SR^{10}$ 、
 5 $-C(S) NHR^{11}$ 、 $-C(S) N(R^{11}) R^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $-C(=NOR^{12}) OR^{10}$ 、 $-C(=NOR^{12}) SR^{10}$ 、
 $-C(=NOR^{12}) NHR^{11}$ 、 $-C(=NOR^{12}) N(R^{11}) R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $-P(O)(R^{14})(OR^{13})$ 、
 $-Si(R^{15})(R^{16}) R^{14}$ 、 $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p_2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、 n が2以上の整数を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、
 10 更に Y^1 、 Y^2 及び Y^3 のうち、何れか2つの Y が隣接する場合には、隣接する2つの Y は
 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R^{17})-$ 、
 $-CH_2N(R^{17})CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、
 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^{17})CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、
 $-N(R^{17})CH=N-$ 、 $-N(R^{17})N=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-OCH_2CH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHN=CH-$
 15 を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R^{18} によって任意に置換されていてもよく、

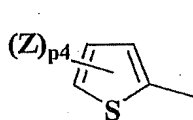
L は、式L-1から式L-58までの何れかで表される芳香族複素環を表し、



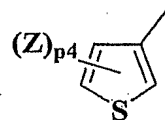
L-1



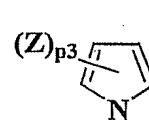
L-2



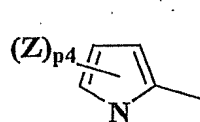
L-3



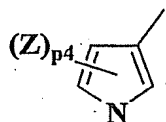
L-4



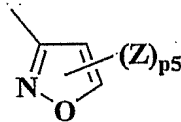
L-5



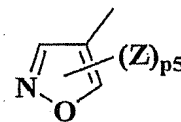
L-6



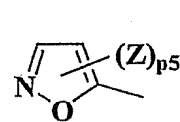
L-7



L-8



L-9

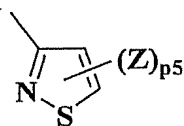


L-10

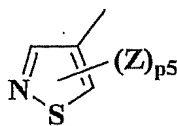
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

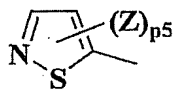
258.



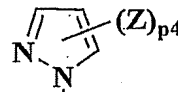
L-11



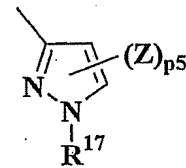
L-12



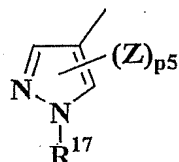
L-13



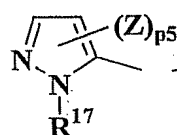
L-14



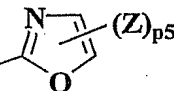
L-15



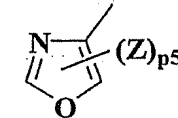
L-16



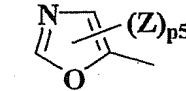
L-17



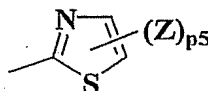
L-18



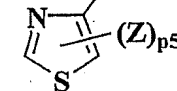
L-19



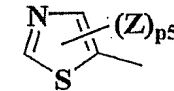
L-20



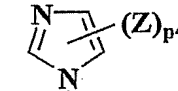
L-21



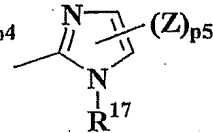
L-22



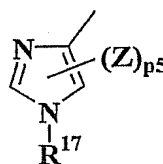
L-23



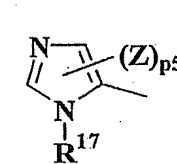
L-24



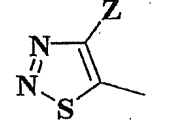
L-25



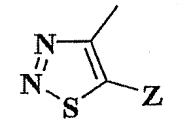
L-26



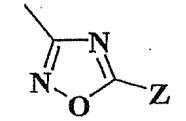
L-27



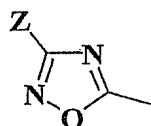
L-28



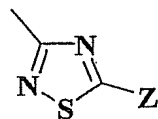
L-29



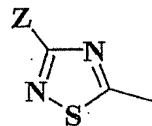
L-30



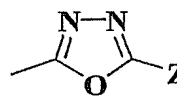
L-31



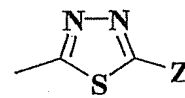
L-32



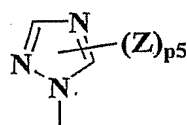
L-33



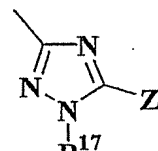
L-34



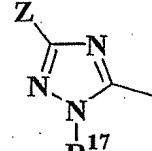
L-35



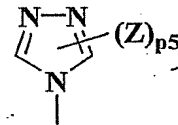
L-36



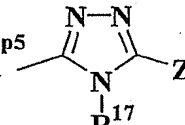
L-37



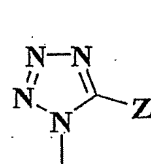
L-38



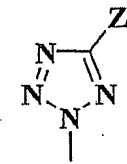
L-39



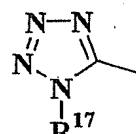
L-40



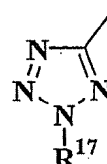
L-41



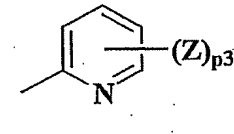
L-42



L-43



L-44

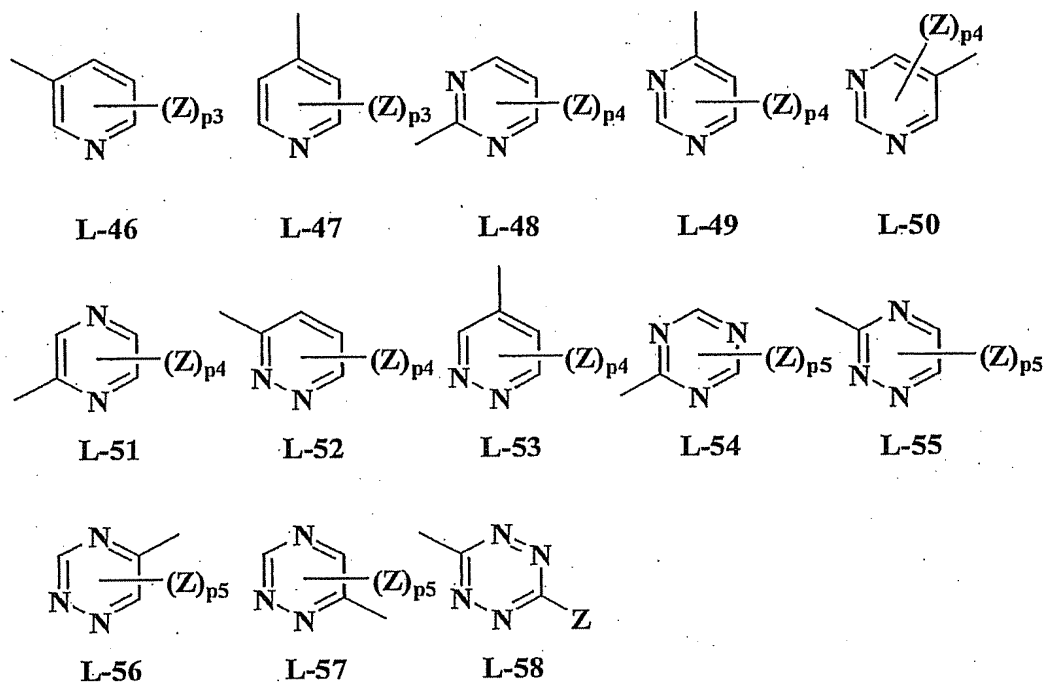


L-45

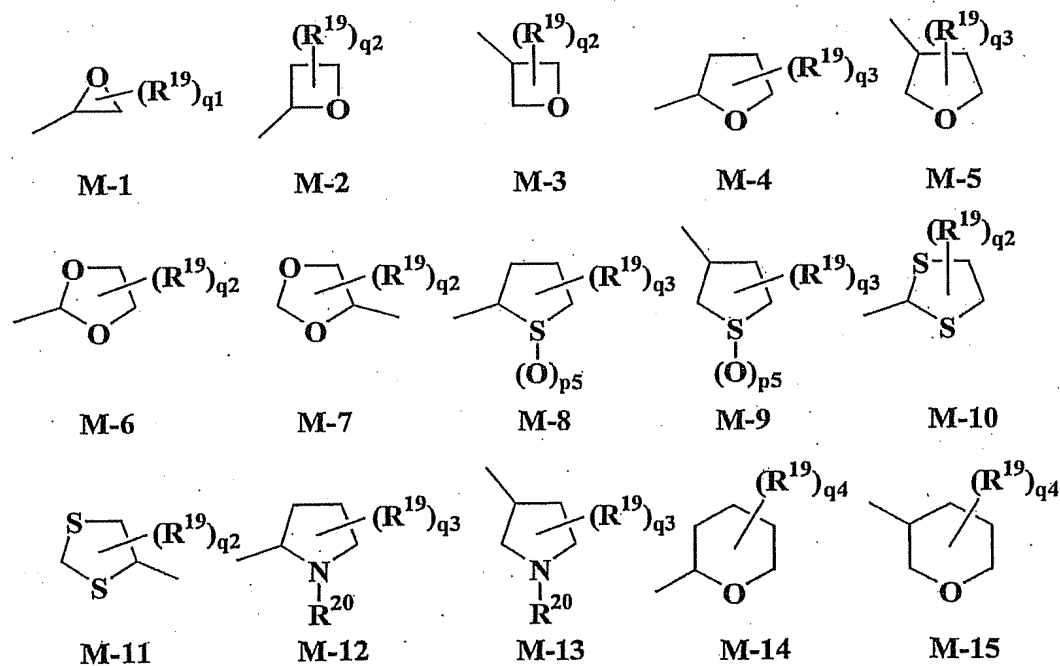
WO 03/011028

PCT/JP02/07833

259



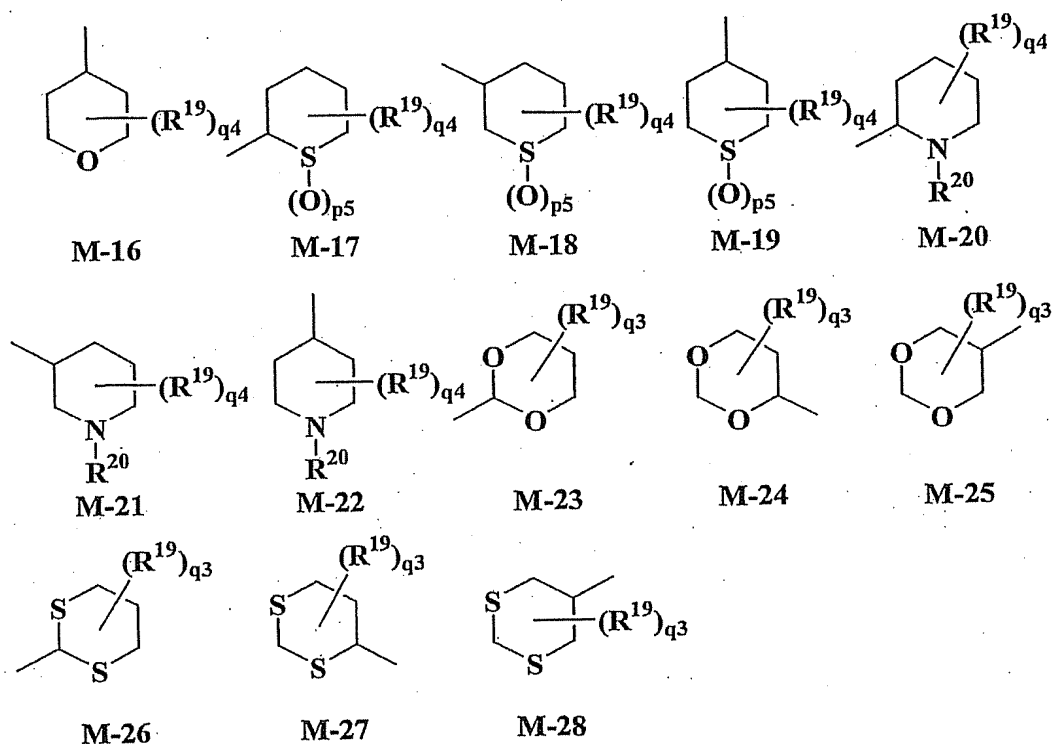
M は、式 M-1 から式 M-28 までの何れかで表される脂肪族複素環を表し、



WO 03/011028

PCT/JP02/07833

260



- Z は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又はフェニルを表し、 p_1 , p_2 , p_3 , p_4 , p_5 又は p_6 が 2 以上の整数を表すとき、各々の Z は互いに同一であっても、または相異なってもよく、
- 10 R^1 , R^2 及び R^3 は、各々独立して水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルキニル、 $-OR^{22}$ 、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、
- 15 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 、 $-N(R^{23})R^{22}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{28})R^{27}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 又は M を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

261

ン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

- 5 R^4 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された($C_1\sim C_{10}$)アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された($C_3\sim C_6$)シクロアルキル、 $C_2\sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された($C_2\sim C_{10}$)アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された($C_2\sim C_{10}$)アルキニル、 $-OH$ 、 $-OR^8$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2R^{29}$ 、 $-NHR^9$ 、 $-N(R^9)R^8$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、
10 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $-P(\text{フェニル})_2$ 、 $-P(O)(\text{フェニル})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 $(Z)_{p6}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 L 又は M を表し、 p が2以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

- 15 R^5 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された($C_1\sim C_6$)アルキル、 $C_2\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって
20 置換されていてもよいフェニルを表し、

- R^{5a} は、水素原子、 $C_1\sim C_5$ アルキル、 $C_1\sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル($C_1\sim C_3$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ($C_1\sim C_3$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ($C_1\sim C_3$)アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1\sim C_3$)アルキル、 $L-(C_1\sim C_3)$ アルキル、 $M-(C_1\sim C_3)$ アルキル、 $C_3\sim C_5$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_5$ ハロシクロアルキル、 $C_3\sim C_5$ アルケニル、
25 $C_3\sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_5$ アルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{5b} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル又は $C_3\sim C_6$ アルキニルを表し、

R^6 は、(i) A が炭素原子を表すとき、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

262

換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

さらに或いは、 R^6 が R^2 と一緒になって $-C(R^{6a})(R^{6b})-$ 又は $-C(O)C(R^{6a})(R^{6b})-$ を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成してもよいことを表し、

(ii) A が窒素原子を表すとき、 R^6 は R^2 と一緒になって $-C(R^{6a})(R^{6b})-$ 又は $-C(O)C(R^{6a})(R^{6b})-$ を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成することを表し、

R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表すか、或いは、 R^{6a} と R^{6b} とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する炭素原子と共に 3 ～ 6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

R^7 は、ハロゲン原子、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^8$ 、 $-ON=C(R^{11})R^{10}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2R^8$ 、 $-NHR^9$ 、 $-N(R^9)R^8$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $-Si(R^{15})(R^{16})R^{14}$ 、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2} によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、

R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30}

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

263

によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)NHR^{11}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2NHR^{11}$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換

5 されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表すか、或いは、 R^8 と R^9 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基によって置換されていてもよく、

20 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、トリメチルシリル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 L ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 M ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

264

又は M を表し、

- R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル基によって置換されていてもよく、
- 10 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $L- (C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $M- (C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、
- 15 R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、
- R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、
- 20 R^{15} 及び R^{16} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、
- R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、
- 25 R^{18} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

265

アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2} によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、同時に2個以上の R¹⁸ で置換されている場合、各々の R¹⁸ は互いに同一であっても、または相異なっているとしてもよく、

R¹⁹ は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、q1, q2, q3 又は q4 が2以上の整数を表すとき、各々の R¹⁹ は互いに同一であっても、または相異なっているとしてもよく、

R²⁰ は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$) アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$) アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノチオカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルスルホニル、-P(O)(OR¹³)₂ 又は-P(S)(OR¹³)₂ を表し、

R²¹ は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、-OH、-OR⁸、-SH、-S(O)₂R²⁹、-NHR⁹、-N(R⁹)R⁸、-CHO、-C(O)R¹⁰、-C(O)OH、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)NHR¹¹、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(O)C(O)OR¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂、-P(フェニル)₂、-P(O)(フェニル)₂、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2} によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、

R²² は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

266

R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^{25} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5～8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジルオキシ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5～8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

267

黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

- R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、 $-SH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)R^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)NHR^{11}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

- R^{30} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)R^{32}$ 、 $-NHR^{33}$ 、 $-N(R^{33})R^{32}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{34}$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OR^{34}$ 、 $-C(R^{34})=NOR^{12}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、
- R^{31} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)R^{32}$ 、 $-NHR^{33}$ 、 $-N(R^{33})R^{32}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $-P(\text{フェニル})_2$ 、 $-P(O)(\text{フェニル})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

- R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノチオカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

268

R^{33} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表すか、或いは、 R^{32} と R^{33} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ

10 ハロゲン原子又はメチル基によって置換されていてもよく、

R^{34} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されて

15 いてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

m は、1～3 の整数を表し、

n は、1～3 の整数を表し、

p は、1～6 の整数を表し、

20 $p1$ は、1～5 の整数を表し、

$p2$ は、1～7 の整数を表し、

$p3$ は、1～4 の整数を表し、

$p4$ は、1～3 の整数を表し、

$p5$ は、1～2 の整数を表し、

25 $p6$ は、1～9 の整数を表し、

$q1$ は、0～3 の整数を表し、

$q2$ は、0～5 の整数を表し、

$q3$ は、0～7 の整数を表し、

$q4$ は、0～9 の整数を表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

269

r は、0～2の整数を表す、

で表される置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

2. 請求の範囲第1項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

3. 請求の範囲第1項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。

4. 請求の範囲第1項記載の一般式(1)で表される化合物において、

A は、炭素原子を表し、

- 10 Y^1 、 Y^2 及び Y^3 は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF₅、C₁～C₆アルキル、 R^7 によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された(C₃～C₆)シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、 R^7 によって任意に置換された(C₂～C₆)アルケニル、C₃～C₈シクロアルケニル、C₃～C₈ハロシクロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、 R^7 によって任意に置換された(C₂～C₆)アルキニル、
- 15 -OH、-OR⁸、-SH、-S(O)_rR⁸、-S(O)₂OR¹⁰、-S(O)₂NHR¹¹、-S(O)₂N(R¹¹)R¹⁰、-NHR⁹、-N(R⁹)R⁸、-CHO、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)NHR¹¹、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)NHR¹¹、-C(S)N(R¹¹)R¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、-C(=NOR¹²)OR¹⁰、-C(=NOR¹²)SR¹⁰、-C(=NOR¹²)NH(R¹¹)、-C(=NOR¹²)N(R¹¹)R¹⁰、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂、-P(O)(R¹⁴)(OR¹³)、-Si(R¹⁵)(R¹⁶)R¹⁴、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、(Z)_{p2}によって置換されていてもよいナフチル、L-1～L-13、L-15～L-35、L-37～L-58又はMを表し、 n が2以上の整数を表すとき、各々のYは互いに同一であっても、または相異なってもよく、更に、 n が2以上の整数であり、且つ2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのYは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N(R¹⁷)-, -CH₂N(R¹⁷)CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-,
- 25 -CH₂CH=CH-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N(R¹⁷)CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N(R¹⁷)CH=N-, -N(R¹⁷)N=CH-, -CH=CHCH=CH-, -OCH₂CH=CH-, -N=CHCH=CH-又は-N=CHN=CH-を形成することにより、それぞれのYが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はR¹⁸によって任意に置換されていてもよく、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

270

R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CH_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は $(Z)_{n1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよい置換アミド化合物又はその塩。

5 10 5. 請求の範囲第 1 項記載の一般式 (1) で表される化合物において、

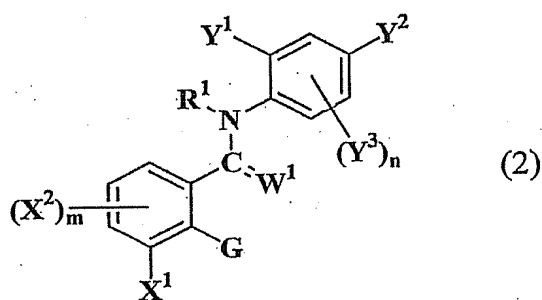
A は、炭素原子又は窒素原子を表し、

G は、G-1 を表し、

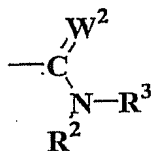
X^1 は、 X^1-1 を表し、

15 R^2 は R^6 と一緒になって $-C(R^{6a})(R^{6b})-$ 又は $-C(O)C(R^{6a})(R^{6b})-$ を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成することを表す置換アミド化合物又はその塩。

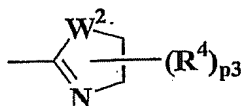
6. 一般式 (2) :



式中、G は、G-1 又は G-2 を表し、



G-1



G-2

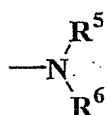
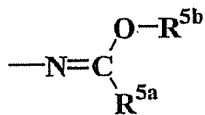
20 W^1 及び W^2 は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

271

X¹は、X¹-1 又は X¹-2 を表し、

X¹-1X¹-2

X²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルホニル又はC₁~C₆ハロアルキルスルホニルを表し、mが2以上の整数

5 を表すとき、各々のX²は互いに同一であっても、または相異なっていてよく、

Y¹は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₄アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄ハロアルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄ハロアルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₂~C₆アルケニルオキシ、C₂~C₆アルキニルオキシ、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェノキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₂~C₆アルケニルチオ、C₂~C₆アルキニルチオ、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルアミノ、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、-Si(R¹⁵)(R¹⁶)R¹⁴、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-51、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、

Y²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、-SF₅、C₁~C₆アルキル、R⁷によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R⁷によって任意に置換された(C₃~C₈)シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、R⁷によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₃~C₈ハロシクロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、R⁷によって任意に置換された(C₂~C₆)アルキニル、-OR^{8a}、-S(O)₂R^{8a}、-S(O)₂OR¹⁰、-S(O)₂N(R¹¹)R¹⁰、-N(R⁹)R^{8b}、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂、-Si(R¹⁵)(R¹⁶)R¹⁴、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-58 又は M を表し、

Y³は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

272

ル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-O-$ (L-17)、 $-O-$ (L-45)、
 $-O-$ (L-48)、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、
 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスル
 ホニル、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-51、M-1、M-6、M-
 5 10、M-23 又は M-26 を表し、 n が 2 又は 3 を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、
 又は相異なっているてもよく、

さらに、 Y^3 が Y^1 又は Y^2 と隣接する場合には、隣接する 2 つの Y^1 と Y^3 又は Y^2 と Y^3 は
 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{17})-$ 、
 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、
 10 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}=\text{N}-$ を形成することにより、それぞれの Y^1 及
 び Y^3 又は Y^2 及び Y^3 が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを
 表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R^{18} によって任意に
 置換されているてもよく、

R^1 及び R^2 は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ ア
 ルコキシ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチ
 15 オ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されているてもよいフェニルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、
 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_2\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカル
 ボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、
 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $-\text{OH}$ 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $-\text{SR}^{24}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{24}$ 、 $-\text{SN}(\text{R}^{26})\text{R}^{25}$ 、 $C_1\sim C_6$ ア
 20 ルキルカルボニル又は $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

R^3 は、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1\sim C_8$) アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロ
 アルキル、ヒドロキシ ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、
 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル ($C_3\sim C_8$) シクロ
 アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$
 25 ハロアルケニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されているてもよいフェニル ($C_3\sim C_6$) アルケニル、L-
 $(C_3\sim C_6)$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換され
 ているてもよいフェニル ($C_3\sim C_6$) アルキニル、L- ($C_3\sim C_6$) アルキニル、 $-\text{OR}^{22}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{23})\text{R}^{22}$ 、L
 又は M を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2\sim C_6$ アルキレン鎖を形成すること
 により、結合する窒素原子と共に 3~7 員環を形成してもよいことを表し、このときこ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

273

のアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてよく、

- 5 R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_{10}$) アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_{10}$) アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p6}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 L 又は M を表し、 p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異なっているいてもよく、
- 10 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 L ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 M ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 又は
- 15 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{5b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

- 25 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されて

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

274

いてもよく、

- R^7 は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、 $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、 $-ON=C(R^{11})R^{10}$ 、 $-O-(L-18)$ 、 $-O-(L-21)$ 、 $-O-(L-25)$ 、 $-O-(L-45)$ 、 $-O-(L-48)$ 、 $-O-(L-49)$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニル又は L を表し、
- 10 R^{8a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $L-17$ 、 $L-18$ 、 $L-21$ 、 $L-25$ 、 $L-45$ 、 $L-48$ 又は $L-49$ を表し、
- 15 R^{8b} は、 $-C(O)R^{10}$ 又は $-C(O)OR^{10}$ を表し、
- R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル表し、
- R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表し、
- 20 R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、
- 25

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

275

R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は (Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル又は (Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に2個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっているてもよく、

R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、-OH、-OR^{8c}、-SH、-S(O)₂R²⁹、-N(R⁹)R^{8c}、-CHO、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、L又はMを表し、

R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(S)N(R¹¹)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-S(O)₂N(R¹¹)R¹⁰、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂又は (Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{22} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は (Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキルを表し、

R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシカルボニル

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

276

ル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

5 R^{25} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に5～8員環を形成してもよいことを表し、このときこの

10 アルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に5～8員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、

25 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-18、L-21、L-25、L-30、L-31、L-32、L-33、L-34、L-35、L-37、L-38、L-40、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

R^{30} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ に

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

277

よって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{31} は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-S(O)R^{32}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、

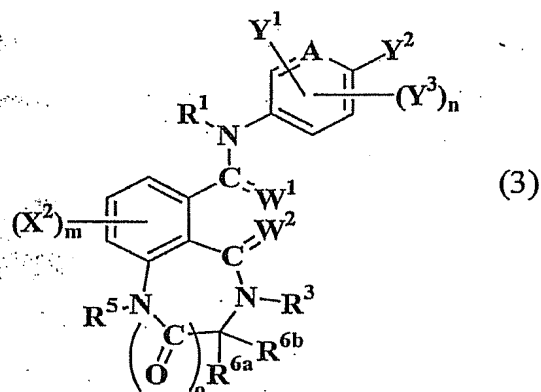
m は、1～3の整数を表し、

n は、1～3の整数を表し、

p は、1～4の整数を表す、

10 で表される請求の範囲第4項記載の置換アミド化合物又はその塩。

7. 一般式 (3) :



式中、 A は、炭素原子又は窒素原子を表し、

W^1 及び W^2 は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

15 X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

20 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

278

C_8 シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})\text{R}^{14}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、

Y² は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、R⁷ によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、R⁷ によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、R⁷ によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、R⁷ によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、 $-\text{OR}^{8a}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{8a}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)\text{R}^{8b}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{13})_2$ 、 $-\text{P}(\text{S})(\text{OR}^{13})_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})\text{R}^{14}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

Y³ は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-\text{O}-(\text{L}-17)$ 、 $-\text{O}-(\text{L}-45)$ 、 $-\text{O}-(\text{L}-48)$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、L、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、n が 2 又は 3 を表すとき、各々の Y³ は互いに同一であっても、又は相異なってもよく、さらに Y¹、Y² 及び Y³ のうち、何れか 2 つが隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{17})-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}=\text{N}-$ を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R¹⁸ によって任意に置換されていてもよく、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

279

R^1 は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_2\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

R^3 は、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1\sim C_8$) アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、ヒドロキシ ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_3\sim C_6$) アルケニル、 $L-(C_3\sim C_6)$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_3\sim C_6$) アルキニル、 $L-(C_3\sim C_6)$ アルキニル、 $-OR^{22}$ 、 $-N(R^{23})R^{22}$ 、 L 又は M を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2\sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

R^5 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_2\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1\sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $L-(C_1\sim C_4)$ アルキル、 $M-(C_1\sim C_4)$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル、 $-OH$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(O)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-S(O)_2N(R^{28})R^{27}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 又は

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

280

(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

- R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル (C₁~C₄) アルキル、ヒドロキシ (C₁~C₆) アルキル、C₁~C₆アルコキシ (C₁~C₄) アルキル、C₁~C₆アルキルチオ (C₁~C₄) アルキル、C₂~C₆シアノアルキル、C₁~C₆アルコキシカルボニル (C₁~C₄) アルキル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル (C₁~C₄) アルキル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル (C₁~C₄) アルキル、ジ (C₁~C₆アルキル) アミノカルボニル (C₁~C₄) アルキル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル (C₁~C₄) アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₂~C₆ハロアルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルコキシカルボニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表すか、或いは、R^{6a} と R^{6b} とが一緒になって C₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する炭素原子と共に 3~6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、C₁~C₆アルキル基、C₁~C₆ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆ハロアルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基又は C₁~C₆ハロアルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

- R⁷ は、ハロゲン原子、-OH、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₂~C₆アルケニルオキシ、C₂~C₆ハロアルケニルオキシ、C₃~C₆アルキニルオキシ、C₃~C₆ハロアルキニルオキシ、C₁~C₆アルコキシカルボニル (C₁~C₄) アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル (C₁~C₄) アルコキシ、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル (C₁~C₄) アルコキシ、-ON=C (R¹¹) R¹⁰、-O- (L-18)、-O- (L-21)、-O- (L-25)、-O- (L-45)、-O- (L-48)、-O- (L-49)、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル又は L を表し、

- R^{8a} は、C₁~C₆アルキル、R³⁰によって任意に置換された (C₁~C₆) アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R³⁰によって任意に置換された (C₃~C₈) シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、R³⁰によって任意に置換された (C₂~C₆) アルケニル、C₂~C₆アルキニル、R³⁰によって任意に置換された (C₂~C₆) アルキニル、C₃~C₈ハロシクロアルケニル、-S (O)₂R¹⁰、-P (O) (OR¹³)₂、-P (S) (OR¹³)₂、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル、L-17、L-18、L-21、L-25、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

281

R^{8b} は、 $-C(O)R^{10}$ 又は $-C(O)OR^{10}$ を表し、

R^9 は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{10} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_2\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル ($C_3\sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表し、

10 R^{11} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3\sim C_8$ シクロアルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2\sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1\sim C_6$ アルキル基又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

15 R^{12} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1\sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル又は $C_3\sim C_6$ アルキニルを表し、

20 R^{13} は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

R^{17} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

25 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

282

ていてもよく、

R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{8c}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_2 R^{29}$ 、 $-N(R^9)R^{8c}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表し、

- 5 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-S(O)_2 R^{10}$ 、 $-S(O)_2 N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{22} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキルを表し、

- 15 R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

- 20 R^{25} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルを表し、

- 25 R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5 ～ 8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

283

R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5 ～ 8 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

- R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、
 10. $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(O)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-18、L-21、L-25、L-30、L-31、L-32、L-33、L-34、L-35、L-37、L-38、L-40、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

- R^{30} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、
 15

R^{31} は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $-OR^{32}$ 、 $-S(O)_2R^{32}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

- R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、
 20

m は、1 ～ 3 の整数を表し、

n は、1 ～ 5 の整数を表し、

o は、0 又は 1 の整数を表す、

で表される請求の範囲第 5 項記載の置換アミド化合物又はその塩。

- 25 8. W^1 及び W^2 は、酸素原子を表し、

X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、プロモジフルオロメトキシ、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はトリフルオロメタンスルホニルを表し、 m が 2 以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

284

同一であっても、または相異なっているとしてもよく、

Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオを表し、

Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $-O-(L-17)$ 、 $-O-(L-45)$ 、 $-O-(L-48)$ 、 $-O-(L-49)$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-S-(L-17)$ 、 $-S-(L-45)$ 、 $-S-(L-48)$ 、 $-S-(L-49)$ 、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、 $-N(R^9)R^{8b}$ 、 $-Si(CH_3)_2R^{14}$ 、 $L-1 \sim L-13$ 、 $L-15 \sim L-35$ 、 $L-37 \sim L-58$ 又は M を表し、

Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

285

- ル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 n が 2 又は 3 を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なっているとき、
- 5 さらに、 Y^3 が Y^1 又は Y^2 と隣接する場合には、隣接する 2 つの Y^1 と Y^3 又は Y^2 と Y^3 は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}=\text{N}-$ を形成することにより、それぞれの Y^1 及び Y^3 又は Y^2 及び Y^3 が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素
- 10 原子は R^{18} によって任意に置換されていてもよく、
- R^1 は、水素原子を表し、
- R^2 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、
- R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_6$) アルキニル、 $(L-3)-(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、 $(L-4)-(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、 $(L-45)-(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、 $(L-46)-(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、M-3、M-5、M-9、M-13、M-15、M-16、M-18、M-19、M-21、M-22、M-25 又は M-28 を表すか、或いは、
- 20 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メチル基又はメトキシ基によって置換されていてもよく、
- R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し、 p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異なっているとき、
- 25 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ア

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

286

ルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、
 ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていても
 よいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、L- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、M- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロ
 アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロア
 5 ルキニル、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、-SR²⁴、-S(O)₂R²⁴、-SN(R²⁶)R²⁵、
 -SN(R²⁶)R²⁵、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノスルホニル、
 -CHO、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(O)C(O)OR¹⁰、-C(S)OR¹⁰、
 -C(S)SR¹⁰ 又は -C(S)N(R¹¹)R¹⁰ を表し、

R⁵ は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコ
 10 キシカルボニルを表すか、或いは、R⁵ と R⁶ とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成
 することにより、結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよいことを表し、こ
 のときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を
 含んでもよく、且つ酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

R¹⁴ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

15 R¹⁷ は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R¹⁸ は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は (Z)_{p1} によって置換さ
 れていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R¹⁸ で置換されている場合、各々の R¹⁸
 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

20 R²¹ は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、-OH、-OR^{8c}、-SH、-S(O)₂R²⁹、
 -N(R⁹)R^{8c}、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニ
 ルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-CH=NOR¹²、-C(R¹⁰)=NOR¹²、
 (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

25 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim$
 C_6 アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$)
 アルキル、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、-C(S)N(R¹¹)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、
 -S(O)₂N(R¹¹)R¹⁰、-P(O)(OR¹³)₂、-P(S)(OR¹³)₂ 又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェ
 ニルを表し、

R¹⁰ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim$
 C_6 アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$)

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

287

アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

- 5 R^{11} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3 ～ 6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基によって置換されていてもよく、

- 10 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_3 \sim C_6$ アルケニルを表し、

- 15 R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

- 20 R^{31} は、ハロゲン原子、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表す請求の範囲第 6 項記載の置換アミド化合物又はその塩。

9. W^1 及び W^2 は、酸素原子を表し、

- 25 X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はトリフルオロメタンスルホニルを表し、 m が 2 以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

288

によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオを表し、

- 5 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$)
- 10 アルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_2 \sim C_6$) ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $-O-$ (L-17)、 $-O-$ (L-45)、 $-O-$ (L-48)、 $-O-$ (L-49)、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $-S-$ (L-17)、 $-S-$ (L-45)、 $-S-$ (L-48)、 $-S-$ (L-49)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、 $-N(R^9)R^{8b}$ 、 $-Si(CH_3)_2R^{14}$ 、L 又は M を表し、
- 25 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 n が 2 又は 3 を表すとき、各々

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

289

の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なってもよく、

さらに Y^1 、 Y^2 及び Y^3 のうち、何れか 2 つが隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は

$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, $-\text{OCH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$, $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$,
 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$, $-\text{OCH}=\text{N}-$, $-\text{SCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^{17})\text{CH}=\text{N}-$ を形成すること

- 5 により、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R^{18} によって任意に置換されていてもよく、

R^1 は、水素原子を表し、

- R^3 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(\text{C}_1\sim\text{C}_8)$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロ
 10 アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルチオ ($\text{C}_3\sim\text{C}_8$) シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルスルフィニル ($\text{C}_3\sim\text{C}_8$) シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルスルホニル ($\text{C}_3\sim\text{C}_8$) シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルケ
 ニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_8$) アルキニ
 ル、 $(L-3) - (\text{C}_1\sim\text{C}_8)$ アルキニル、 $(L-4) - (\text{C}_1\sim\text{C}_8)$ アルキニル、 $(L-45) - (\text{C}_1\sim\text{C}_8)$ アルキニル、
 $(L-46) - (\text{C}_1\sim\text{C}_8)$ アルキニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、ジ ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル) アミノ、 $M-3$ 、 $M-5$ 、
 15 $M-9$ 、 $M-13$ 、 $M-15$ 、 $M-16$ 、 $M-18$ 、 $M-19$ 、 $M-21$ 、 $M-22$ 、 $M-25$ 又は $M-28$ を表すか、或いは、
 R^2 と R^3 とが一緒になって $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子
 と共に 3 ～ 7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、
 硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メ
 チル基又はメトキシ基によって置換されていてもよく、

- 20 R^5 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、
 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルチオ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって
 置換されていてもよいフェニルチオ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ シアノアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ア
 ルコキシカルボニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルアミノカルボニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、
 ジ ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル) アミノカルボニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていても
 25 よいフェニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $L - (\text{C}_1\sim\text{C}_4)$ アルキル、 $M - (\text{C}_1\sim\text{C}_4)$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロ
 アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ ハロアルケニル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ ハロア
 ルキニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、
 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されてい
 てもよいフェニルスルホニル、 $-\text{SN}(\text{R}^{20})\text{R}^{25}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

290

アルキル) アミノスルホニル、 $-\text{CHO}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルカルボニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニル又は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシカルボニルを表し、

R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ又は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニルを表し、

5 R^{14} は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル又は $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{17} は、水素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル又は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルを表し、

R^{18} は、ハロゲン原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル又は $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

10 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{8c}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{29}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^9)\text{R}^{8c}$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニル、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{10})=\text{NOR}^{12}$ 、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表し、

R^{8c} は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{13})_2$ 、 $-\text{P}(\text{S})(\text{OR}^{13})_2$ 又は $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{10} は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $(\text{Z})_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表し、

R^{11} は、水素原子又は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $\text{C}_2\sim\text{C}_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル基によって置換されていてもよく、

R^{12} は、水素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルチオ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシカルボニル ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、ジ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル) アミノカルボニル (C_1

WO 03/011028

PCT/JP02/07833

291

～C₄) アルキル、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル (C₁～C₄) アルキル又は C₃～C₆ アルケニルを表し、

- R²⁹ は、C₁～C₆ アルキル、R³¹ によって任意に置換された (C₁～C₆) アルキル、C₃～C₆ シクロアルキル、C₃～C₆ アルケニル、C₃～C₆ アルキニル、C₁～C₆ アルキルチオ、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルチオ、-C(O)R¹⁰、-C(O)N(R¹¹)R¹⁰、
 5 -C(S)N(R¹¹)R¹⁰、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

- R³¹ は、ハロゲン原子、-OH、C₁～C₆ アルコキシ、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ アルキルカルボニルオキシ、C₁～C₆ ハロアルキルカルボニルオキシ、C₁～C₆ アルキルチオ、C₁～
 10 C₆ ハロアルキルチオ、C₁～C₆ アルキルスルホニル、C₁～C₆ ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆ アルキルカルボニル、C₁～C₆ アルコキシカルボニル、C₁～C₆ アルキルアミノカルボニル、ジ (C₁～C₆ アルキル) アミノカルボニル又は (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニルを表す請求の範囲第 7 項記載の置換アミド化合物又はその塩。

- 1 0. 請求の範囲第 4 項ないし第 9 項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれ
 15 る 1 種又は 2 種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

- 1 1. 請求の範囲第 4 項ないし第 9 項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれ
 る 1 種又は 2 種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

- 1 2. 請求の範囲第 4 項ないし第 9 項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれ
 る 1 種又は 2 種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/07833

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ A01N37/30, 37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C237/40, 237/42,
257/06, C07D239/88, 263/10, 265/08

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ A01N37/30, 37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C237/40, 237/42,
257/06, C07D239/88, 263/10, 265/08

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 02/48137 A2 (E.I. Du Pont de Nemours & Co.), 20 June, 2002 (20.06.02), Claims (Family: none)	1-3
P, X	WO 01/70671 A2 (E.I. Du Pont de Nemours & Co.), 27 September, 2001 (27.09.01), Claims; examples (for example, compound 199 shown on page 173) & AU 200150946 A	1-4, 10-12
A	EP 1006107 A2 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 07 June, 2000 (07.06.00), Claims; page 32; table 1; No. 308 & AU 9961790 A & CZ 9904099 A3 & ZA 9907318 A & CN 1255491 A & KR 2000035763 A & JP 2001-131141 A & BR 9905766 A & HU 9904444 A2	1-12

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not
considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing
date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is
cited to establish the publication date of another citation or other
special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other
means

"P" document published prior to the international filing date but later
than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or
priority date and not in conflict with the application but cited to
understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered novel or cannot be considered to involve an inventive
step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered to involve an inventive step when the document is
combined with one or more other such documents, such
combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
24 October, 2002 (24.10.02)

Date of mailing of the international search report
19 November, 2002 (19.11.02)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/07833

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

Insecticides containing as the active ingredient substituted amides having basic skeletons represented by the general formula (1) in claim 1 are publicly known (see EP 919542 A2 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 1999.06.02). Thus, claim 1 discloses at least six inventions resulting from combinations of three cases wherein G is G-1, G-2, or G-3 by two cases wherein X¹ is X¹-1 or X¹-2, which do not form a single general inventive concept.

Since claims 2-12 relate respectively to compounds of claim 1 limited in use and specific ones of the substituted amides represented by the general formula (1) in claim 1, claims 1-12 also involve six inventions which do not
(continued to extra sheet)

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: 1-12Parts relating to compounds of the general formula (1) wherein G is G-1 and X¹ is X¹-1.Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/07833

Continuation of Box No.II of continuation of first sheet(1)

form a single general inventive concept, as long as claim 1 contains six inventions which do not form a single general inventive concept.

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO2/07833

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.¹ A01N37/30, 37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C237/40, 237/42, 257/06, C07D239/88, 263/10, 265/08

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.¹ A01N37/30, 37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C237/40, 237/42, 257/06, C07D239/88, 263/10, 265/08

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
PX	WO 02/48137 A2 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2002. 06. 20 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-3
PX	WO 01/70671 A2 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2001. 09. 27 特許請求の範囲, 実施例 (例えば、第173頁化合物199等) &AU 200150946 A	1-4, 10-12
A	EP 1006107 A2 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 2000. 06. 07 特許請求の範囲, 第32頁表1No. 308 &AU 9961790 A &CZ 9904099 A3 &ZA 9907318 A &CN 1255491 A	1-12

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

24. 10. 02

国際調査報告の発送日

19.11.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

爾見 武志

4H

9547

電話番号 03-3581-1101 内線 3443

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP02/07833

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	&KR 2000035763 A &JP 2001-131141 A &BR 9905766 A &HU 9904444 A2	

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP02/07833

第I欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☐ 請求の範囲 _____ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

請求の範囲1に記載された一般式(1)で表される基本骨格を有する置換アミド化合物を有効成分として含有する殺虫剤は公知である (EP 919542 A2 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 1999.06.02参照)。よって、請求の範囲1には、少なくとも、GがG-1、G-2、G-3の3通りであるものと、X¹がX¹-1、X¹-2の2通りであるものと組み合わせからなる、3×2=6個の単一の一般的発明概念を形成しない発明が記載されている。

請求の範囲2-12は、請求の範囲1の用途を限定したものに関する発明、あるいは請求の範囲1の一般式(1)で表される置換アミド化合物を限定したものに関する発明であるから、請求の範囲1に単一の一般的発明概念を形成しない6発明が存在する以上、請求の範囲1-12においても、単一の一般的発明概念を形成しない6発明が存在する。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☒ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

請求の範囲1-12において、一般式(1)で表される化合物のうち、GがG-1、かつX¹がX¹-1である化合物に関する部分。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

様式PCT/ISA/210 (第1ページの続葉 (1)) (1998年7月)